



⑮ **BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND**



**DEUTSCHES  
PATENT- UND  
MARKENAMT**

⑫ **Offenlegungsschrift**  
⑩ **DE 199 05 278 A 1**

⑤ Int. Cl. 7:  
**C 07 D 498/04**  
C 07 D 513/04  
C 07 D 515/04  
A 61 K 31/42

⑲ Aktenzeichen: 199 05 278.6  
⑳ Anmeldetag: 9. 2. 1999  
㉑ Offenlegungstag: 10. 8. 2000

**DE 199 05 278 A 1**

⑦ Anmelder:  
Bayer AG, 51373 Leverkusen, DE

⑧ Erfinder:  
Bartel, Stephan, Dr., 51515 Kürten, DE; Raddatz,  
Siegfried, Dr., 51065 Köln, DE; Härter, Michael, Dr.,  
42489 Wülfrath, DE; Rosentreter, Ulrich, Dr., 42349  
Wuppertal, DE; Wild, Hanno, Dr., 42113 Wuppertal,  
DE; Endermann, Rainer, Dr., 42113 Wuppertal, DE;  
Kroll, Hein-Peter, Dr., 42115 Wuppertal, DE

**Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen**

- ⑤ Oxazolidinone und ihre Verwendung als antibakterielle Mittel
- ⑥ Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte Oxazolidinone, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Arzneimittel, insbesondere als antibakterielle Arzneimittel.

**DE 199 05 278 A 1**

## Beschreibung

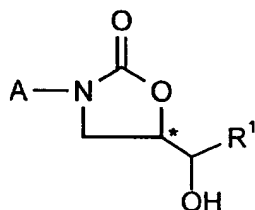
Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte Oxazolidinone, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Arzneimittel, insbesondere als antibakterielle Arzneimittel.

Aus den Publikationen US 5 254 577, US 4 705 799, EP 311 090, EP 312 000 und C. H. Park et al., J. Med. Chem. 35, 1156 (1992), sind N-Aryloxazolidinone mit antibakterieller Wirkung bekannt. Außerdem sind 3-(Stickstoffsubstituier- te)phenyl-5-beta-amidomethyloxazolidin-2-one aus der EP 609 905 A1 bekannt.

Ferner sind in der EP 609 441 und EP 657 440 Oxazolidinonderivate mit einer Monoaminoxidase-inhibitorischen Wirkung und in der EP 645 376 mit Wirkung als Adhäsionsrezeptor-Antagonisten publiziert.

Desweiteren sind aus der EP-A-0738726 und aus WO-9737980-A Hydroxymethylsubstituierte Oxazolidinone be- kannt.

Die Erfindung betrifft neue Hydroxymethyl-substituierte Oxazolidinone der allgemeinen Formel (I):



(I)

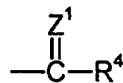
in welcher

R<sup>1</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen ist, das gegebenenfalls mit 1 bis 3 Substituenten substituiert ist, die aus der Gruppe ausgewählt werden, die besteht aus Halogen, Cyano, Hydroxy, geradkettigem oder verzweigtem Alkoxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Mercapto, geradkettigem oder verzweigtem Alkylthio mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen und -NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, worin

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff bedeuten, oder

R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet, und

R<sup>3</sup> einen Rest der Formeln



bedeutet, worin

Z<sup>1</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,

R<sup>4</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Trifluormethyl bedeutet, oder

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Halogen oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist, oder

Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen 5- bis 6-gliedrigen gesättigten oder aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, wobei die unter R<sup>4</sup> aufgeführten Ringsysteme gegebenenfalls bis zu 2-fach gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy oder Phenyl substituiert sind, oder

R<sup>4</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenoxy, Benzyloxy, Carboxyl, Halogen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Koh-

lenstoffatomen oder durch einen 5-bis 6-gliedrigen Heterocyclus aus der Reihe S, N und/oder O substituiert ist, oder

R<sup>4</sup> einen Rest der Formel -NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet, worin

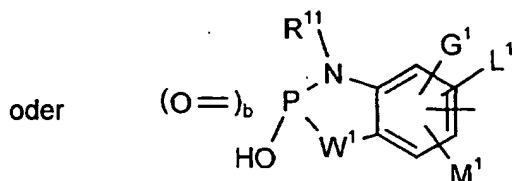
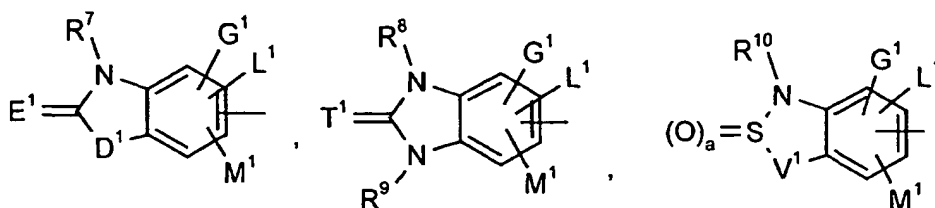
R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl, Pyridyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch über N-gebundenes Morpholin substituiert ist, oder

R<sup>1</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen; geradkettiges oder verzweigtes Alkynyl mit 2

bis 6 Kohlenstoffatomen; geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen; Aryl mit 6 bis

10 Kohlenstoffatomen oder -CONR<sup>2</sup>R<sup>3</sup> ist, worin R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebene Bedeutungen von R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> aufwei- sen, oder

A für einen Rest der Formeln



steht, worin

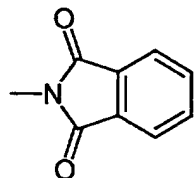
$G^1$ ,  $L^1$  und  $M^1$  gleich oder verschieden sind und

für Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder für eine Gruppe der Formel  $-CO-NR^{12}R^{13}$  stehen, worin

$R^{12}$  und  $R^{13}$  gleich oder verschieden sind und

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten,

$R^7$  Wasserstoff, Cycloalkylcarbonyl oder Cycloalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Cyano, Azido, Trifluormethyl, Pyridyl, Halogen, Hydroxy, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder durch eine Gruppe der Formel  $-(CO)_c-NR^{14}R^{15}$ ,  $R^{16}-N-SO_2-R^{17}$ ,  $R^{18}R^{19}-N-SO_2-$ ,  $R^{20}-S(O)_d$  oder



substituiert ist, worin

$c$  eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

$R^{14}$ ,  $R^{15}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{18}$  und  $R^{19}$ , die oben angegebene Bedeutung von  $R^{12}$  und  $R^{13}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

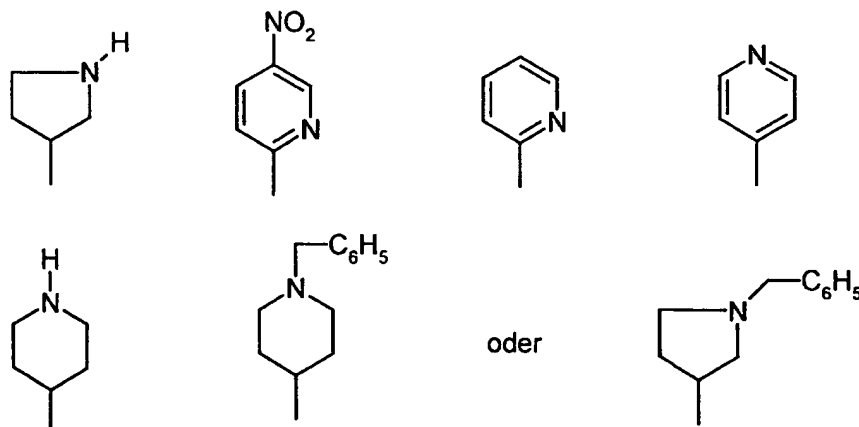
oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6-gliedrigen, gesättigten Heterocyclus mit gegebenenfalls einem weiteren Heteroatom aus der Serie N, S und/oder O bilden, der seinerseits gegebenenfalls, auch an einem weiteren Stickstoffatom, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

$d$  eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

$R^{17}$  und  $R^{20}$  gleich oder verschieden sind und geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen,

Benzyl, Phenyl oder Tölyl bedeuten,

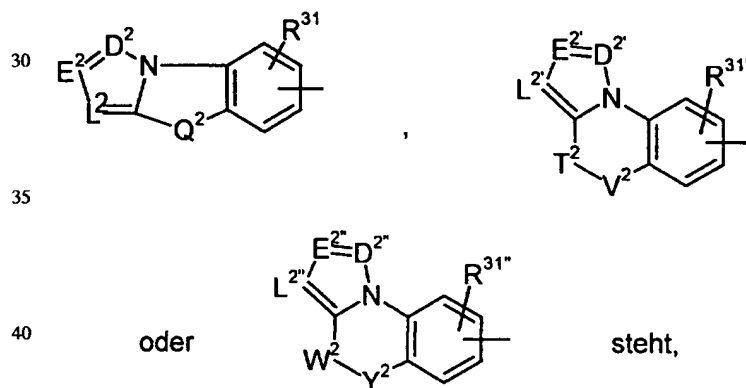
oder  $R^7$  einen Rest der Formeln



bedeutet oder

$R^7$  eine Gruppe der Formel  $-COCl_3$  oder geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

- das gegebenenfalls durch  $-CF_3$ ,  $-CCl_3$  oder eine Gruppe der Formel  $-OR^{21}$  substituiert ist, worin  $R^{21}$  Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Aryl mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist, oder
- $R^7$  eine Gruppe der Formel  $-(CO)_e-NR^{22}R^{23}$ ,  $-NR^{24}-SO_2R^{25}$ ,  $R^{27}R^{26}N-SO_2$  oder  $R^{28}-S(O)_f$  bedeutet, worin
- 5 e die oben angegebene Bedeutung von c hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$  und  $R^{24}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{14}$ ,  $R^{15}$  und  $R^{16}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,  $R^{26}$  und  $R^{27}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{12}$  und  $R^{13}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, f die oben angegebene Bedeutung von d hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,  $R^{25}$  und  $R^{28}$  die oben angegebene Bedeutungen von  $R^{17}$  und  $R^{19}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,
- 10  $D^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,  $E^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel  $NH$  bedeutet,  $T^1$  ein Sauerstoffatom oder die  $NH$ -Gruppe bedeutet,  $R^8$  und  $R^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder
- 15  $T^1$  ein Schwefelatom bedeutet, mit der Maßgabe, daß  $R^8$  und  $R^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben, aber nicht für Wasserstoff stehen, oder im Fall, daß  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  nicht für Wasserstoff stehen,  $E^1$  und/oder  $T^1$  eine Gruppe der Formel  $NR^{29}$  bedeuten, worin  $R^{29}$  mit Ausnahme von Wasserstoff die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,
- 20 oder  $R^{29}$  Cyano oder eine Gruppe der Formel  $-CO_2R^{30}$  bedeutet, worin  $R^{30}$  Benzyl oder Phenyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Nitro oder Halogen substituiert sind  $V^1$  und  $W^1$  die oben angegebene Bedeutung von  $D^1$  haben oder die oben aufgeführte Gruppe  $N-R^9$  bedeuten und mit dieser gleich oder verschieden sind, a eine Zahl 1 oder 2 bedeutet,
- 25 b eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder A für Reste der Formeln



- worin
- 45  $R^{31}$ ,  $R^{31'}$  und  $R^{31''}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Halogen bedeuten,  $D^2$ ,  $D^2$  und  $D^2$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $CR^{32}$  bedeuten, worin  $R^{32}$  Wasserstoff, Trifluormethyl, Halogen, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel  $-NR^{33}R^{34}$  bedeutet, worin  $R^{33}$  und  $R^{34}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten,
- 50  $E^2$ ,  $E^2$  und  $E^2$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $CR^{35}$  bedeuten, worin  $R^{35}$  Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano oder Halogen bedeutet, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sind, oder
- 55 Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, wobei die Ringsysteme gegebenenfalls bis zu 3-fach gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Trifluormethyl substituiert sind, oder
- $R^{35}$  Reste der Formeln  $O-R^{36}$ ,  $-CO-R^{37}$  oder  $-NR^{38}R^{39}$  bedeutet, worin
- 60  $R^{36}$  Wasserstoff, Benzoyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet,  $R^{37}$  Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, oder
- 65  $R^{37}$  eine Gruppe der Formel  $-NR^{40}R^{41}$  bedeutet, worin  $R^{40}$  und  $R^{41}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten,

R<sup>38</sup> und R<sup>39</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Benzyl, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder eine Gruppe der Formel -CO<sub>2</sub>R<sup>42</sup> oder -CM<sup>2</sup>-NR<sup>43</sup>R<sup>44</sup> bedeuten, worin

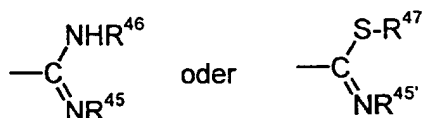
R<sup>42</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet,

M<sup>2</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,

R<sup>43</sup> und R<sup>44</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>33</sup> und R<sup>34</sup> haben, oder

R<sup>38</sup> Wasserstoff bedeutet und

R<sup>39</sup> einen Rest der Formel



bedeutet, worin

R<sup>45</sup> und R<sup>45'</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten,

R<sup>46</sup> und R<sup>47</sup> gleich oder verschieden sind und geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Phenyl oder Benzyl bedeuten,

L<sup>2</sup>, L<sup>2'</sup> und L<sup>2''</sup> gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel CR<sup>48</sup> bedeuten, worin

R<sup>48</sup> Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano, Halogen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl oder durch einen Rest der Formel -OR<sup>49</sup> substituiert ist, worin

R<sup>49</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet, oder

R<sup>48</sup> Reste der Formeln -OR<sup>50</sup>, -COR<sup>51</sup> oder -NR<sup>52</sup>R<sup>53</sup> bedeutet, worin

R<sup>50</sup> Wasserstoff, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

R<sup>51</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>39</sup> hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

R<sup>52</sup> und R<sup>53</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>33</sup> und R<sup>34</sup> haben und mit diesen gleich oder verschieden sind, oder

R<sup>52</sup> Wasserstoff bedeutet und

R<sup>53</sup> Cyano oder einen Rest der Formel -CO-NR<sup>54</sup>R<sup>55</sup> oder -CS-NR<sup>56</sup>R<sup>57</sup> bedeutet, worin

R<sup>54</sup>, R<sup>55</sup>, R<sup>56</sup> und R<sup>57</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>35</sup> und R<sup>36</sup> haben, oder R<sup>52</sup> und R<sup>53</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6-gliedrigen, gesättigten Heterocyclen bilden, der noch ein weiteres Heteroatom aus der Reihe S, O oder einen Rest der Formel -NH enthalten kann,

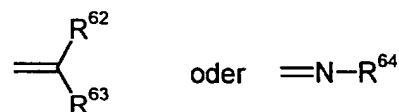
Q<sup>2</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder Reste der Formeln SO<sub>2</sub>, SO, C=O oder CR<sup>58</sup>R<sup>59</sup> bedeutet, worin

R<sup>58</sup> und R<sup>59</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Halogen bedeuten,

T<sup>2</sup> einen Rest der Formel CR<sup>60</sup>R<sup>61</sup> bedeutet, worin

R<sup>60</sup> und R<sup>61</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyloxy bedeuten, oder

R<sup>60</sup> und R<sup>61</sup> gemeinsam Reste der Formeln =O, =S,



bilden, worin

R<sup>62</sup> und R<sup>63</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten, oder

R<sup>62</sup> und R<sup>63</sup> gemeinsam einen 3- bis 6-gliedrigen, gesättigten oder partiell ungesättigten Carbocyclen bilden, und

R<sup>64</sup> Wasserstoff, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

V<sup>2</sup> ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom oder einen Rest der Formel SO oder SO<sub>2</sub> bedeutet,

W<sup>2</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet, oder Reste der Formeln C=O, C=S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>65</sup> oder CR<sup>66</sup>R<sup>67</sup> bedeutet, worin

R<sup>65</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>64</sup> hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

R<sup>66</sup> und R<sup>67</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten, oder

R<sup>66</sup> Wasserstoff bedeutet und

R<sup>67</sup> einen Rest der Formel -OR<sup>68</sup> bedeutet, worin

R<sup>68</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet,

Y<sup>2</sup> einen Rest der Formel C=O oder -CR<sup>69</sup>R<sup>70</sup> bedeutet, worin

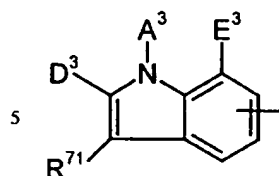
R<sup>69</sup> und R<sup>70</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Halogen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder

R<sup>69</sup> Wasserstoff bedeutet und

R<sup>70</sup> Hydroxy, Benzyloxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, oder

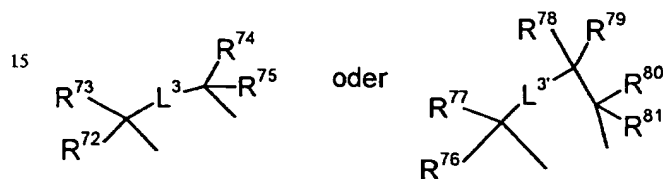
W<sup>2</sup> und Y gemeinsam für die Gruppe -CH=CH- stehen, oder

A für einen Rest der Formel

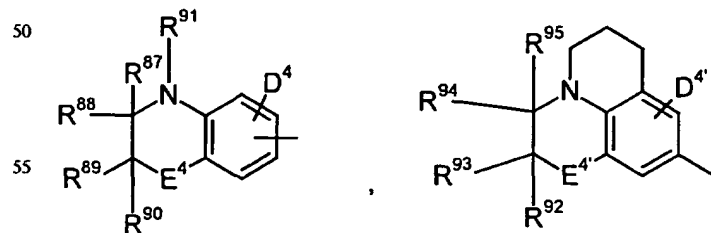


steht, in welcher

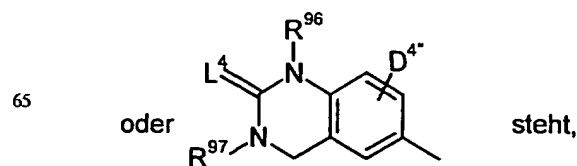
- 10 R<sup>71</sup> für Wasserstoff, Halogen oder für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen steht,  
 E<sup>3</sup> für Wasserstoff oder für Halogen steht,  
 A<sup>3</sup> und D<sup>3</sup> gemeinsam unter Einbezug des Stickstoffatoms einen heterocyclischen Rest der Formel



- 20 bilden, worin  
 L<sup>3</sup> und L<sup>3'</sup> gleich oder verschieden sind und ein Sauerstoffatom oder einen Rest der Formel -NR<sup>82</sup> bedeuten, worin  
 R<sup>82</sup> Wasserstoff, Carboxyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl  
 mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, oder  
 25 geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel -NR<sup>83</sup>R<sup>84</sup> substituiert ist, worin  
 R<sup>83</sup> und R<sup>84</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder  
 30 geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, die gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel -NR<sup>83'</sup>R<sup>84'</sup> substituiert sind, worin  
 R<sup>83'</sup> und R<sup>84'</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>83</sup> und R<sup>84</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, und/oder Alkyl oder Alkenyl gegebenenfalls durch Aryl mit 6 bis 14 Kohlenstoffatomen substituiert sind, das seinerseits  
 35 durch Halogen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,  
 R<sup>72</sup>, R<sup>73</sup>, R<sup>74</sup> und R<sup>75</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch Halogen substituiert ist, oder  
 R<sup>72</sup> und R<sup>73</sup> und/oder R<sup>74</sup> und R<sup>75</sup> gemeinsam Reste der Formel =O, oder =S bilden,  
 40 R<sup>76</sup>, R<sup>77</sup>, R<sup>78</sup>, R<sup>79</sup>, R<sup>80</sup> und R<sup>81</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel -NR<sup>85</sup>R<sup>86</sup> substituiert ist, worin  
 R<sup>85</sup> und R<sup>86</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>83</sup> und R<sup>84</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder  
 45 R<sup>76</sup> und R<sup>77</sup> und/oder R<sup>78</sup> und R<sup>79</sup> und/oder R<sup>80</sup> und R<sup>81</sup> gemeinsam Reste der Formel =O oder =S bilden und/oder  
 R<sup>79</sup> und R<sup>80</sup> gemeinsam eine endocyclische Doppelbindung bilden, oder  
 A für Reste der Formeln



60



steht worin

D<sup>4</sup>, D<sup>4'</sup> und D<sup>4''</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, E<sup>4</sup> und E<sup>4'</sup> gleich oder verschieden sind und eine -CH<sub>2</sub>-Gruppe, ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder einen Rest der Formel -SO oder -SO<sub>2</sub> bedeuten,

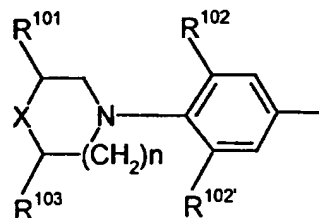
L<sup>4</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel =NR<sup>98</sup> bedeutet, worin

R<sup>98</sup> Wasserstoff, Phenyl, Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, R<sup>87</sup>, R<sup>88</sup>, R<sup>89</sup>, R<sup>90</sup>, R<sup>92</sup>, R<sup>93</sup>, R<sup>94</sup> und R<sup>95</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, die gegebenenfalls durch Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder durch einen 5- bis 6-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O substituiert sind, die ihrerseits ein- bis mehrfach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Alkyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Hydroxy oder Halogen substituiert sein können, oder R<sup>87</sup> und R<sup>88</sup>, R<sup>89</sup> und R<sup>90</sup>, R<sup>92</sup> und R<sup>93</sup> und/oder R<sup>94</sup> und R<sup>95</sup> gemeinsam Gruppen der Formel =O, =CH<sub>2</sub> oder =CHR<sup>99</sup> bilden, worin

R<sup>99</sup> Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen 5- bis 7-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, wobei die Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach durch Halogen, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind,

R<sup>91</sup>, R<sup>96</sup> und R<sup>97</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder einen Rest der Formel -CO-R<sup>100</sup> bedeuten, worin

R<sup>100</sup> Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, ein 5- bis 7-gliedriger aromatischer Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist, wobei die unter R<sup>100</sup> aufgeführten Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Trifluormethyl, Nitro, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind, oder A eine Gruppe der Formel



worin

X O, S, SO, SO<sub>2</sub>, S(O)NR<sup>104</sup> oder S(O)<sub>2</sub>NR<sup>104</sup> ist;

worin R<sup>104</sup> Wasserstoff, wahlweise durch ein bis drei Substituenten ausgewählt aus Chlor, Fluor, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, Amino und Mono- oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylamino substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder p-Toluolsulfonyl ist,

R<sup>101</sup> Wasserstoff ist, und,

wenn X O ist, R<sup>101</sup> Wasserstoff-CH<sub>3</sub>, -CN, -CO<sub>2</sub>H, -CO<sub>2</sub>R<sup>105</sup>, worin

R<sup>105</sup> Wasserstoff, wahlweise durch ein bis drei Substituenten ausgewählt aus Chlor, Fluor, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Acyloxy und -OCH<sub>2</sub>-Ph substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Cycloalkyl, Amino, Mono- oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy ist, oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>g</sub>R<sup>106</sup> ist, worin g 1 oder 2 und R<sup>106</sup> Wasserstoff, -OR<sup>105</sup>, -OCOR<sup>105</sup>, -NH<sub>2</sub>, -NHCOR<sup>105</sup> oder -N(R<sup>104</sup>)<sub>2</sub> ist, worin R<sup>105</sup> und R<sup>105</sup>, die oben angegebenen Bedeutungen aufweisen, und R<sup>102</sup> und R<sup>102'</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Chlor oder Fluor bedeuten,

R<sup>103</sup> Wasserstoff oder Methyl ist,

n 0, 1 oder 2 ist

und tautomere Formen und/oder Salze davon.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in stereoisomeren Formen, die sich entweder wie Bild und Spiegelbild (Enantiomere), oder die sich nicht wie Bild und Spiegelbild (Diastereomere) verhalten, existieren. Die Erfindung betrifft sowohl die Enantiomeren oder Diastereomeren oder deren jeweilige Mischungen. Die Racemformen lassen sich ebenso wie die Diastereomeren in bekannter Weise in die stereoisomere einheitlichen Bestandteile trennen.

Folgendes Formelschema veranschaulicht die entsprechend gekennzeichneten Schreibweisen für enantiomerenreine und racemische Formen:



(A) (racemisch)

(B) (enantiomer)

Desweiteren können die Verbindungen gegebenenfalls auch in tautomeren Formen vorliegen.

Physiologisch unbedenkliche Salze der erfindungsgemäßen Verbindungen können Salze der erfindungsgemäßen Stoffe mit Mineralsäuren, Carbonsäuren oder Sulfonsäuren sein. Besonders bevorzugt sind z. B. Salze mit Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Methansulfonsäure, Ethansulfonsäure, Toluolsulfonsäure, Benzolsulfonsäure, Naphthalindisulfonsäure, Essigsäure, Propionsäure, Milchsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Fumarsäure, Maleinsäure oder Benzoesäure.

Als Salze können weiterhin Salze mit üblichen Basen genannt werden, wie beispielsweise Alkalimetallsalze (z. B. Natrium- oder Kaliumsalze), Erdalkalisalze (z. B. Calcium- oder Magnesiumsalze) oder Ammoniumsalze, abgeleitet von Ammoniak oder organischen Aminen wie beispielsweise Diethylamin, Triethylamin, Ethyldiisopropylamin, Prokain, Dibenzylamin, N-Methylmorpholin, Dihydroabietylamin, 1-Ephenamin oder Methylpiperidin.

Cycloalkyl steht im allgemeinen für einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen. Beispielsweise seien Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl genannt. Bevorzugt sind der Cyclopropyl-, Cyclopentan- und der Cyclohexanring.

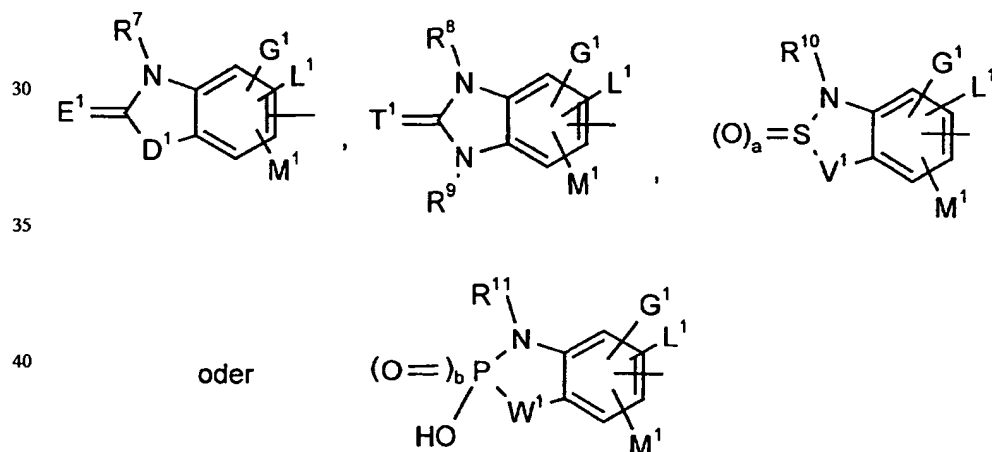
Aryl steht im allgemeinen für einen aromatischen Rest mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen. Bevorzugte Arylreste sind Phenyl und Naphthyl.

Acyl bzw. (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Acyl steht im Rahmen der Erfindung für einen geradkettigen oder verzweigten Acylrest mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen. Bevorzugt ist ein geradkettiger oder verzweigter Niedrigacylrest mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Bevorzugte Acylreste sind Acetyl und Propionyl.

Alkoxy bzw. (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy steht im Rahmen der Erfindung für einen geradkettigen oder verzweigten Alkoxyrest mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen. Bevorzugt ist ein geradkettiger oder verzweigter Niedrigalkoxyrest mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Beispielsweise seien genannt: Methoxy, Ethoxy, Propoxy, Isopropoxy, tert.-Butoxy, n-Pentoxy und n-Hexoxy.

Alkoxy-carbonyl bzw. (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy-carbonyl steht im Rahmen der Erfindung für einen geradkettigen oder verzweigten Alkoxy-carbonylrest mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen. Bevorzugt ist ein geradkettiger oder verzweigter Niedrigalkoxy-carbonylrest mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Beispielsweise seien genannt: Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, tert.-Butoxycarbonyl, n-Pentoxycarbonyl und n-Hexoxycarbonyl.

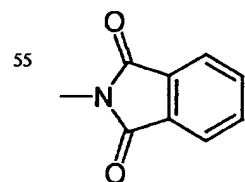
Bevorzugt sind in einer Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin A für einen Rest der Formeln



steht,

worin G<sup>1</sup>, L<sup>1</sup> und M<sup>1</sup> für Wasserstoff stehen,

R<sup>7</sup> Wasserstoff, Cyclopropylcarbonyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, die gegebenenfalls durch Cyano, Azido, Trifluormethyl, Pyridyl, Fluor, Chlor, Brom, Pyridyl, Hydroxy, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Benzyloxycarbonyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, und/oder durch eine Gruppe der Formel - (CO)<sub>c</sub>-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>-N-SO<sub>2</sub>-R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>-N-SO<sub>2</sub>, R<sup>20</sup>-S(O)<sub>d</sub> oder



substituiert ist,

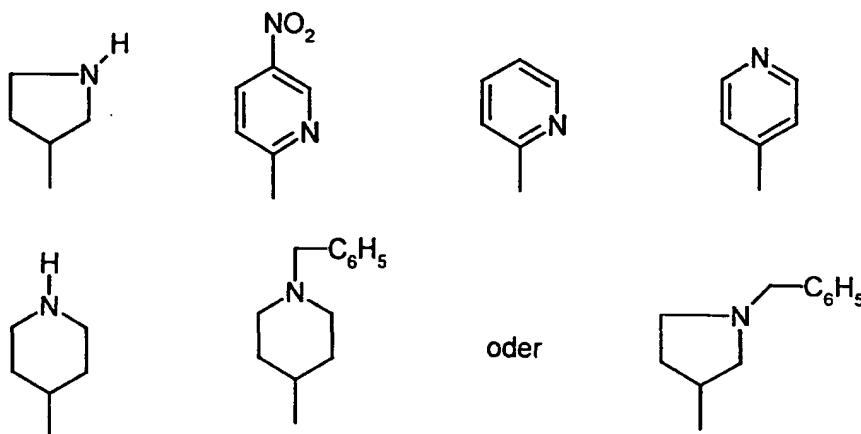
c eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

worin R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Methyl oder Ethyl bedeuten,

d eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

R<sup>17</sup> und R<sup>20</sup> gleich oder verschieden sind und geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, Benzyl, Phenyl oder TolyI bedeuten, oder R<sup>7</sup> einen Rest der Formeln





bedeutet oder

$R^7$  eine Gruppe der Formel  $-COCl_3$  oder geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch  $-CF_3$ ,  $-CCl_3$  oder eine Gruppe der Formel  $-OR^{21}$  substituiert ist, worin

$R^{21}$  Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl substituiert ist, oder

$R^7$  eine Gruppe der Formel  $-(CO)_e-NR^{22}R^{23}$  oder  $R^{28}-S(O)_f$  bedeutet, worin

e die Zahl 1 ist,

$R^{22}$  und  $R^{23}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Methyl oder Ethyl bedeuten,

f die oben angegebene Bedeutung von d hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

$R^{28}$  Methyl, Phenyl, Toly oder Benzyl bedeutet,

$D^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,

$E^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel NH bedeutet,

$T^1$  ein Sauerstoffatom oder die NH-Gruppe bedeutet,

$R^8$  und  $R^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder

$T^1$  ein Schwefelatom bedeutet,

mit der Maßgabe, daß  $R^8$  und  $R^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben, aber nicht für Wasserstoff stehen,

oder im Fall, daß  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  nicht für Wasserstoff stehen,  $E^1$  und/oder  $T^1$  eine Gruppe der Formel  $NR^{29}$  bedeuten, worin  $R^{29}$  mit Ausnahme von Wasserstoff die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

oder  $R^{29}$  Cyano oder eine Gruppe der Formel  $-CO_2R^{30}$  bedeutet, worin

$R^{30}$  Benzyl oder Phenyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Nitro oder Halogen substituiert sind;

$V^1$  und  $W^1$  die oben angegebene Bedeutung von  $D^1$  haben oder die oben aufgeführte Gruppe  $N-R^9$  bedeuten und mit dieser gleich oder verschieden sind,

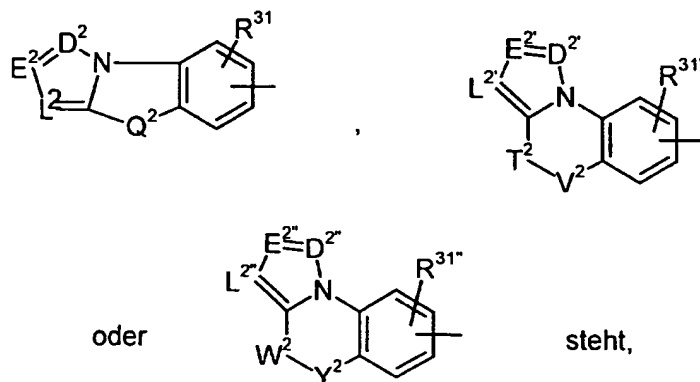
a eine Zahl 1 oder 2 bedeutet,

b eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

$R^{10}$  und  $R^{11}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

und tautomere Formen und/oder Salze davon.

Bevorzugt sind in einer weiteren Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin A für einen Rest der Formeln, worin A ausgewählt wird aus der Gruppe der Formeln:



worin

$R^{31}$ ,  $R^{31'}$  und  $R^{31''}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Fluor bedeuten,

$D^2$ ,  $D^2'$  und  $D^2''$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $CR^{32}$  bedeuten, worin  $R^{32}$  Wasserstoff, Trifluormethyl, Chlor, Fluor, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet,

$E^2$ ,  $E^2'$  und  $E^2''$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $CR^{35}$  bedeuten, worin

$R^{35}$  Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlen-

stoffatomen oder Benzyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Hydroxy substituiert sind, oder Phenyl, Naphtyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Pyrazinyl, Thienyl oder Furyl bedeutet, oder

R<sup>35</sup> Reste der Formeln O-R<sup>36</sup>, -CO-R<sup>37</sup> oder -NR<sup>38</sup>R<sup>39</sup> bedeutet, worin

R<sup>36</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet,

R<sup>37</sup> Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet, oder

R<sup>37</sup> eine Gruppe der Formel -NR<sup>40</sup>R<sup>41</sup> bedeutet, worin

R<sup>40</sup> und R<sup>41</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeuten,

R<sup>38</sup> und R<sup>39</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Benzyl, Phenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen oder eine Gruppe der Formel -CO<sub>2</sub>R<sup>42</sup> bedeuten, worin

R<sup>42</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet,

L<sup>2</sup>, L<sup>2</sup> und L<sup>2</sup> gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel CR<sup>48</sup> bedeuten, worin

R<sup>48</sup> Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl oder durch einen Rest der Formel -OR<sup>49</sup> substituiert ist, worin R<sup>49</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet, oder

R<sup>48</sup> Reste der Formeln -OR<sup>50</sup>, -COR<sup>51</sup> oder -NR<sup>52</sup>R<sup>53</sup> bedeutet, worin

R<sup>50</sup> Wasserstoff, Phenyl, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet,

R<sup>51</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>39</sup> hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

R<sup>52</sup> und R<sup>53</sup> die oben angegebene Bedeutung von und R<sup>34</sup> haben und mit diesen gleich oder verschieden sind,

Q<sup>2</sup> ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder Reste der Formeln SO<sub>2</sub>, SO, C=O oder CR<sup>58</sup>R<sup>59</sup> bedeutet, worin

R<sup>58</sup> und R<sup>59</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Fluor bedeuten,

T<sup>2</sup> einen Rest der Formel -CR<sup>60</sup>R<sup>61</sup> bedeutet, worin

R<sup>60</sup> und R<sup>61</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Fluor, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen oder Benzyloxy bedeuten, oder

R<sup>60</sup> und R<sup>61</sup> gemeinsam Reste der Formeln =O oder =S bilden,

V<sup>2</sup> ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom oder einen Rest der Formel SO oder SO<sub>2</sub> bedeutet,

W<sup>2</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet, oder Reste der Formeln C=O, C=S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>65</sup> oder CR<sup>66</sup>R<sup>67</sup> bedeutet, worin

R<sup>65</sup> Wasserstoff, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet,

R<sup>66</sup> und R<sup>67</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Fluor, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten, oder

Y<sup>2</sup> einen Rest der Formel C=O oder -CR<sup>69</sup>R<sup>70</sup> bedeutet, worin

R<sup>69</sup> und R<sup>70</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Fluor, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten,

und tautomere Formen und/oder Salze davon.

Bevorzugt sind in einer weiteren Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin A für einen Rest der Formeln

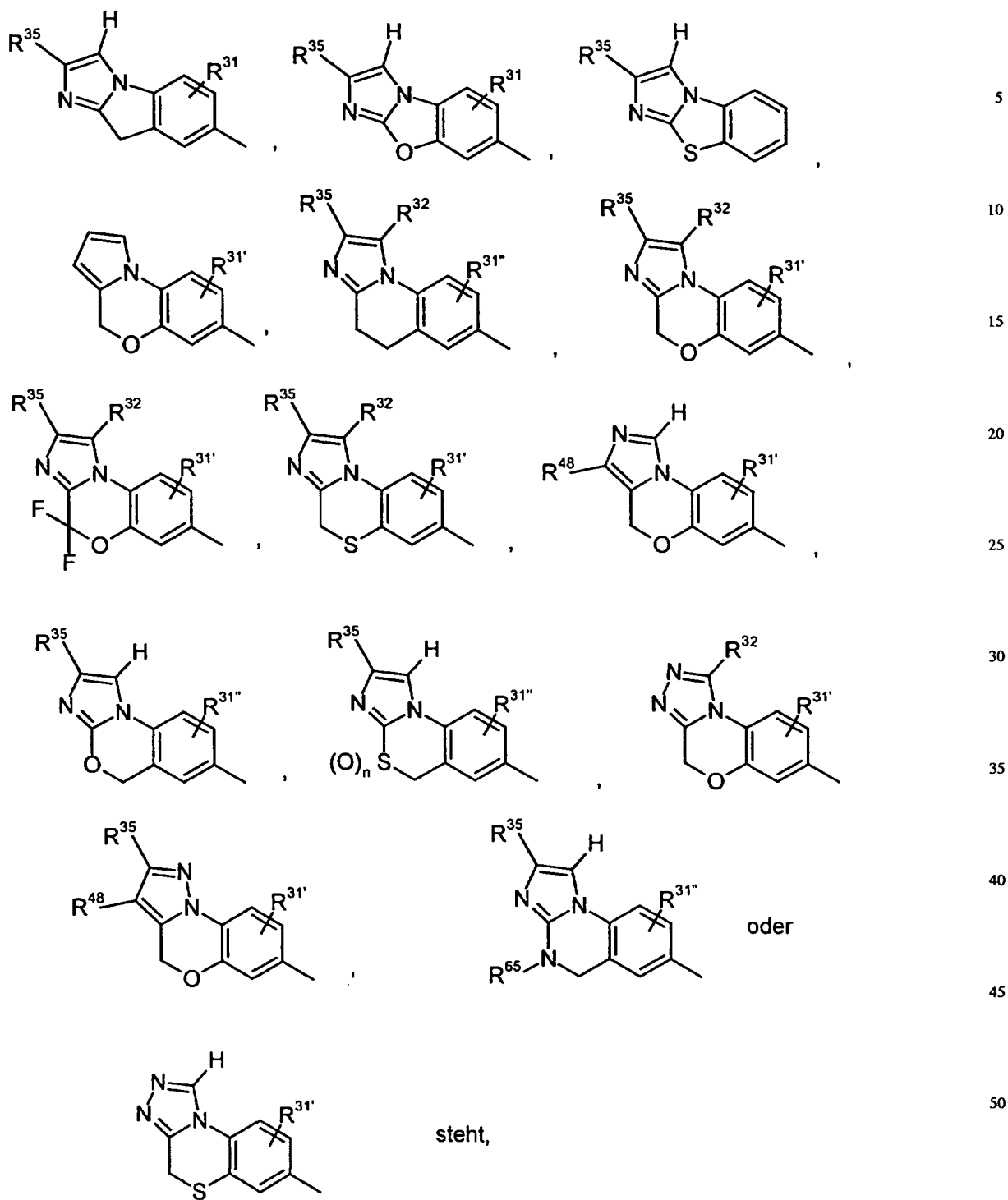
45

50

55

60

65



worin

n eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

$R^{31}$ ,  $R^{31'}$  und  $R^{31''}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Fluor bedeuten,

$R^{32}$  und  $R^{48}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder für Methyl stehen,

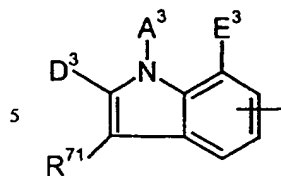
$R^{35}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Trifluormethyl, Phenyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxycarbonyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen steht,

$R^{65}$  Wasserstoff oder Methyl bedeutet,

und tautomere Formen und/oder Salze davon.

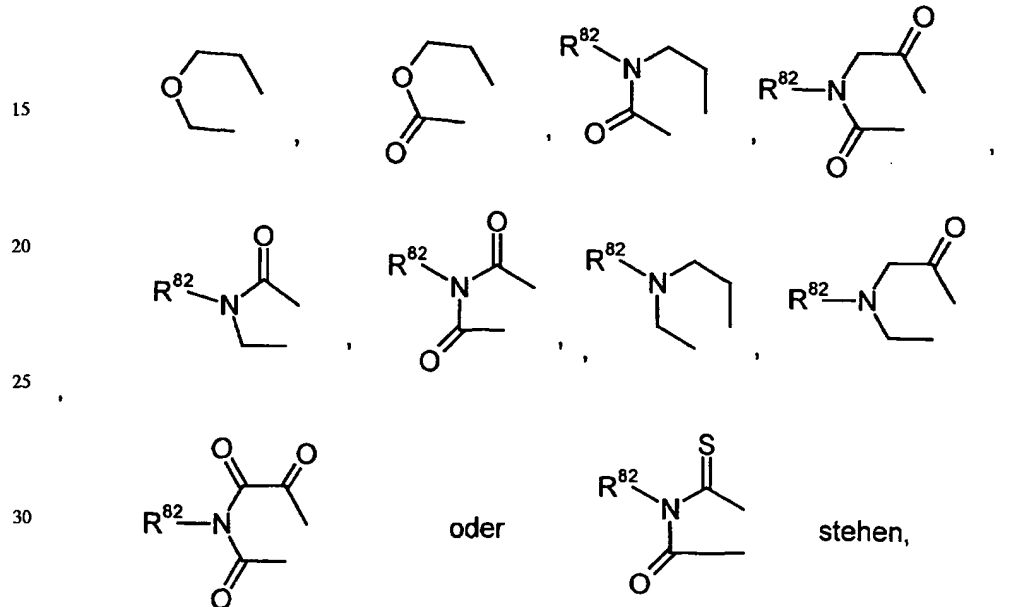
Bevorzugt sind in einer weiteren Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin A für einen Rest der Formeln

65



steht, in welcher

10 A³ und D³ gemeinsam unter Einbezug des Stickstoffatoms einen heterocyclischen Rest der Formel



35 in welcher

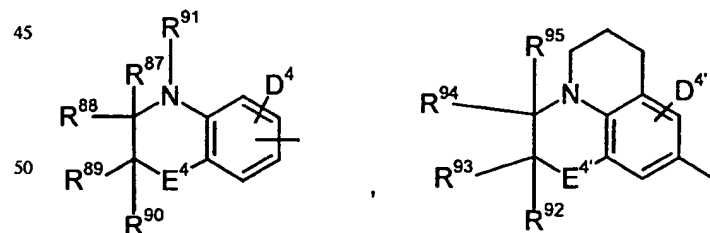
R⁸² Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Cyano, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Amino, N,N-Dimethylamino oder durch Phenyl substituiert ist, oder geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Hydroxy, Amino oder N,N-Dimethylamino substituiert ist, oder Methoxycarbonyl bedeutet,

40 E für Wasserstoff oder Fluor steht,

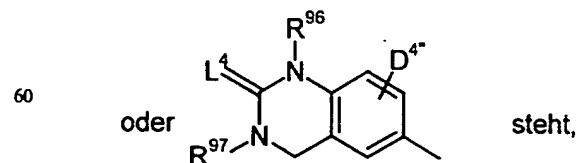
R⁷¹ für Wasserstoff, Fluor steht,

und tautomere Formen und/oder Salze davon.

Bevorzugt sind in einer weiteren Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin A für einen Rest der Formeln



55



worin

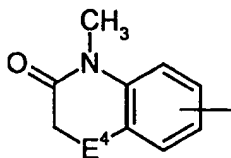
65 D⁴, D⁴' und D⁴'' gleich oder verschieden sind und Wasserstoff bedeuten,

E⁴ und E⁴' gleich oder verschieden sind und die -CH₂ Gruppe, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder einen Rest der Formel -SO oder -SO₂ bedeuten,

L⁴ ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel -NR⁹⁸ bedeutet, worin

R<sup>98</sup> Wasserstoff, Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet,  
 R<sup>87</sup>, R<sup>88</sup>, R<sup>89</sup>, R<sup>90</sup>, R<sup>92</sup>, R<sup>93</sup>, R<sup>94</sup> und R<sup>95</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweig-  
 tes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch Phenyl oder Naphthyl substituiert ist, die  
 ihrerseits ein- bis mehrfach durch Methoxy, Fluor oder Chlor substituiert sein können,  
 R<sup>87</sup> und R<sup>88</sup>, R<sup>89</sup> und R<sup>90</sup>, R<sup>92</sup> und R<sup>93</sup> und/oder R<sup>94</sup> und R<sup>95</sup> gemeinsam Gruppen der Formel =O, =CH<sub>2</sub> oder =CHR<sup>99</sup> 5  
 bilden, worin  
 R<sup>99</sup> Phenyl oder Pyridyl bedeutet, wobei die Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach durch Fluor, Chlor, oder  
 durch Methoxy substituiert sind,  
 R<sup>91</sup>, R<sup>96</sup> und R<sup>97</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy-car-  
 bonyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder  
 einen Rest der Formel -CO-R<sup>100</sup> bedeuten, worin 10  
 R<sup>100</sup> Phenyl, Naphthyl, Pyridyl, Thienyl, Furyl, Imidazolyl, Pyridazolyl, Pyrimidyl oder geradkettiges oder verzweigtes  
 Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl oder Naphthyl substituiert ist, wobei  
 die unter R<sup>15</sup> aufgeführten Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor,  
 Brom, Trifluormethyl, Nitro, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 15  
 Kohlenstoffatomen substituiert sind,  
 sowie tautomere Formen und/oder Salze davon.

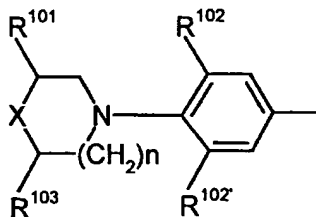
Bevorzugt sind in einer weiteren Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin A für einen Rest der Formeln



steht, worin

E<sup>4</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet, oder die CH<sub>2</sub>-Gruppe bedeutet,  
 und Tautomere und/oder Salze davon.

Bevorzugt sind in einer weiteren Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin A für einen Rest der Formeln



steht, worin

X O ist;

R<sup>101</sup> und R<sup>103</sup> Wasserstoff ist, und,

R<sup>102</sup> und R<sup>102'</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Chlor oder Fluor bedeuten,

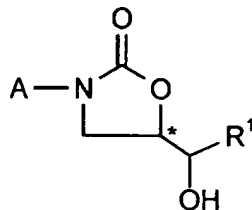
R<sup>103</sup> Wasserstoff ist,

n 1 ist,

und Tautomere und/oder Salze davon.

Bevorzugt sind in einer weiteren Ausführungsform der Erfindung Verbindungen, worin R<sup>1</sup> ausgewählt wird aus Vinyl,  
 Ethinyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Allyl, Benzyl, Phenyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.

Gegenstand der Erfindung ist weiterhin ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I):



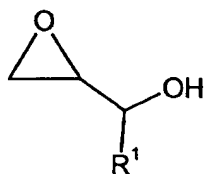
(I)

das umfaßt:

[A] die Umsetzung der Verbindungen der allgemeinen Formel (II)

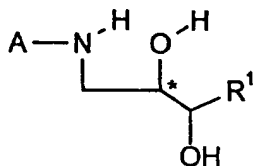
A-NH<sub>2</sub> (II)

mit enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



(III)

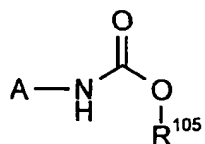
worin A und R<sup>1</sup> die im Anspruch 1 angegebene Bedeutung besitzen, in inerten Lösemitteln und in Anwesenheit eines Hilfsmittels zu enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der Formel (IV)



(IV)

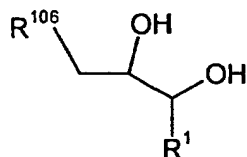
die weiter mit Carbonyl-diimidazol in inerten Lösemitteln zu enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) cyclisiert werden, oder

[B] die Umsetzung von Verbindungen der Formel (V)



(V)

worin A die im Anspruch 1 angegebene Bedeutung aufweist und R<sup>105</sup> wahlweise substituiertes, vorzugsweise durch 1 bis 3 Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, wie z. B. Methyl, Ethyl, Propyl oder Trifluormethyl, Phenyl, substituiertes Phenyl, bevorzugt 2- oder 4-Nitrophenyl, oder bevorzugt Benzyl ist, mit enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der allgemeinen Formel (VI)



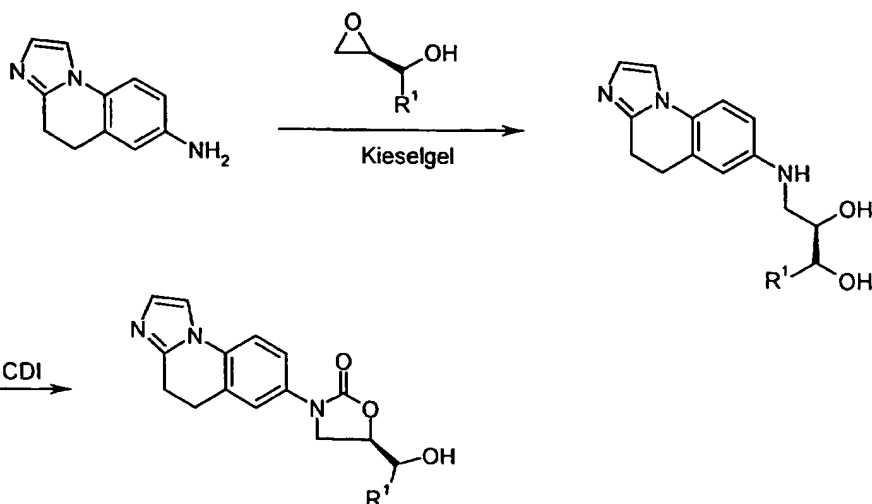
worin R<sup>1</sup> die im Anspruch 1 angegebene Bedeutung aufweist und R<sup>106</sup> eine übliche Abgangsgruppe ist, wie z. B. Halogen, wie Chlor oder Brom, oder -O-SO<sub>2</sub>-R<sup>107</sup>, worin R<sup>107</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, oder gegebenenfalls (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsubstituiertes Phenyl ist, in Gegenwart von Basen zu Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und gegebenenfalls anschließend die Umwandlung am Rest R<sup>1</sup> in z. B. Ester oder Amide nach üblichen Methoden.

Als hier verwendete Basen eignen sich in Abhängigkeit von den einzelnen Verfahrensschritten für das Verfahren [B] die üblichen anorganischen oder organischen Basen. Hierzu gehören bevorzugt Alkalihydroxide wie beispielsweise Natrium- oder Kaliumhydroxid oder Alkalicarbonat wie Natrium- oder Kaliumcarbonat oder Alkalialkoholate wie beispielsweise Natrium- oder Kaliummethanolat oder Natrium- oder Kaliumethanolat oder Natrium- oder Kalium-tert.-butoxid oder organische Amine wie Ethyldiisopropylamin, Triethylamin, Picolin, Pyridine oder N-Methylpiperidin, oder Amide wie Natriumamid oder Lithiumdiisopropylamid oder Lithium-N-silylalkylamide, wie beispielsweise Lithium-N-(bis)triphenylsilylamid oder Lithiumalkyle wie n-Butyllithium.

Basen, wie z. B. Lithium-, oder Natrium- oder Kalium-tert.-amylalkoholat sind besonders bevorzugt für den Schritt [B].

Das erfindungsgemäße Verfahren [A] kann beispielhaft durch folgendes Schema dargestellt werden:

[A]



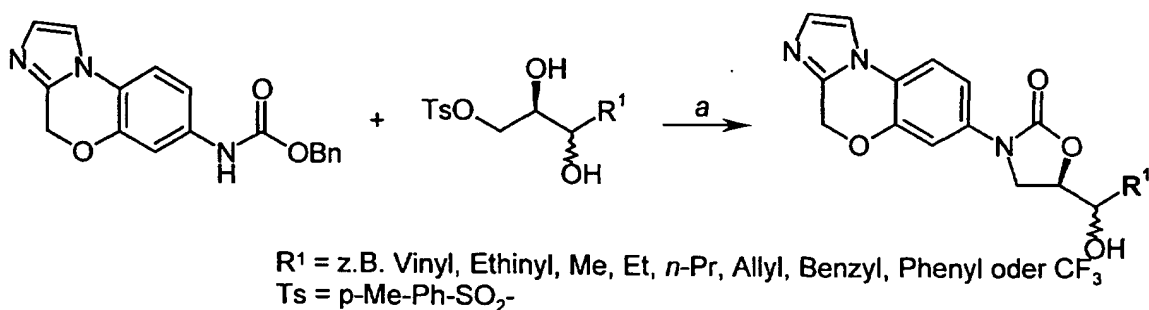
Als Lösemittel für das Verfahren [A] eignen sich die üblichen Lösemittel. Bevorzugt sind Dichlormethan und Chloroform für die Umsetzung mit dem Epoxid und THF für den Ringschluß.

Als Hilfsmittel zur Umsetzung mit dem Epoxid eignen sich schwach saure Katalysatoren, z. B. Kieselgel oder Reaktionsführung unter Druck.

Als Reagenzien für den Ringschluß eignen sich Carbonylverbindungen wie Carbonyldiimidazol, Phosgen, Diphosgen oder Triphosgen, oder Chlorameisensäureester wie Ethyl-, Phenyl-, Nitrophenyl-, Benzyl- oder Isobutyl-chlorformiat, gegebenenfalls in Anwesenheit von Basen wie Triethylamin, Pyridin oder Ethyldiisopropylamin. Bevorzugt ist Carbonyldiimidazol (CDI).

Im allgemeinen wird in einem Temperaturbereich von  $-78^{\circ}\text{C}$  bis  $+50^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise bei Raumtemperatur, gearbeitet. Beim Ringschluß mit CDI liegt die Reaktionstemperatur zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des Tetrahydrofurans.

Das erfindungsgemäße Verfahren [B] kann beispielhaft durch folgendes Schema dargestellt werden: (Für  $\text{R}^1 = \text{H}$  ist ein analoges Verfahren in der WO 97/37980 beschrieben).



a: z. B. 3.1 Äquiv. tert.-Amylalkohol/2.1 Äquiv. n-BuLi, Dimethylacetamid,  $0^{\circ}\text{C}/30 \text{ min. } 22^{\circ}\text{C}/15 \text{ h.}$

Für dieses Verfahren geeignete Lösungsmittel sind z. B.:

Amide wie N,N-Dimethylacetamid, N-Methylpyrrolidin-2-on oder N,N,N',N',N'',N''-Hexamethylphosphorsäuretriamid oder Ether wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, Glykoldimethylether oder Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, Xylol, Hexan, Cyclohexan oder Erdölfraktionen. Ebenso ist es möglich, Gemische der genannten Lösemittel zu verwenden. Bevorzugt sind N,N-Dimethylacetamid und N-Methylpyrrolidin-2-on.

Die Temperatur der Umsetzung liegt zweckmäßig zwischen  $-78^{\circ}\text{C}$  und  $+80^{\circ}\text{C}$ . Bevorzugt ist ein Temperaturbereich zwischen  $-15^{\circ}\text{C}$  und Raumtemperatur.

Alle Umsetzungen werden im allgemeinen bei normalem, erhöhtem oder bei erniedrigtem Druck durchgeführt (z. B. 0,5 bis 5 bar). Im allgemeinen arbeitet man bei Normaldruck.

Die Darstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (II):

A-NH<sub>2</sub> (II)

erfolgt durch Reduktion der Verbindungen der Formel (VII)

A-NO<sub>2</sub> (VII).

Die Reduktionen können im allgemeinen durch Wasserstoff in Wasser oder in inerten organischen Lösemitteln wie Alkoholen, Ethern oder Halogenkohlenwasserstoffen oder Ammoniumformiat oder deren Gemischen mit Katalysatoren wie Raney-Nickel, Palladium, Palladium auf Tierkohle oder Platin oder mit Hydriden oder Boranen in inerten Lösemitteln, gegebenenfalls in Anwesenheit eines Katalysators, durchgeführt werden.

Als Lösemittel eignen sich hierbei alle inerten organischen Lösemittel, die sich unter den Reaktionsbedingungen nicht verändern. Hierzu gehören bevorzugt Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol oder Isopropanol oder Ether wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, Glykoldimethylether oder Diethylen glykoldimethylether oder Amide wie Hexamethylphosphorsäuretriamid oder Dimethylformamid oder Essigsäure. Ebenso ist es möglich, Gemische der genannten Lösemittel zu verwenden. Besonders bevorzugt ist Methanol.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (VII) sind größtenteils bekannt oder als Species neu und können dann im Fall der 4H-Pyrrolo[1,2][1,4]-benzoxazine in Analogie zu bekannten Publikationen M. Kato, Chem. Pharm. Bull. Jpn. 43, 1995, 1358–63, im Fall der substituierten oder unsubstituierten 4H-1,2,4-Triazolo[3,4-c][1,4]-benzoxazinen zu den Publikationen L. Garanti, J. Het. Chem. 13, 1976, 1339–41; B. P. Medaer, Tetrahedron 52, 1996, 8813–26; B. P. Medaer, Tetrahedron 35, 1994, 9767–9776 und im Fall der 4H-Pyrazolo[5,1-c][1,4]benzoxazinen W.-D. Rudolf, J. Prakt. Chem. 329, 1987, 55–61 und 348; im Fall der 4H-Imidazo-[2,1-c][1,4]-benzoxazine in Analogie zu H. Bartsch, J. Het. Chem. 26, 1989, 205–7 hergestellt werden.

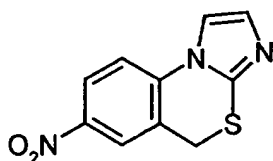
Im Fall der 4,5-Dihydro-imidazo[1,2-a]-chinaline werden zunächst die entsprechenden Nitro-3,4-dihydro-1H-chinolin-2-one durch Umsetzung mit Schwefelsäure und Kaliumnitrat bei  $-15^{\circ}\text{C}$  in die 2-(2-Dimethoxyethylamino)-nitro-3,4-dihydrochinoline umgesetzt, in einem zweiten Schritt in Analogie zu der Publikation T. Jen, J. Med. Chem. 16, 1973, 633–7 mit Triethyloxonium-tetrafluorborat in Dichlormethan und Aminoacetaldehyd-dimethylacetat und abschließend mit Salzsäure versetzt.

Außerdem können die Verbindungen der Formel (VII) hergestellt werden in Analogie zu Reaktionen, die beschrieben sind in Comprehensive Heterocyclic Chemistry (A. R. Katritzky) Vol. 3, Seiten 995–1037 und Vol. 5, Seiten 305–345, 631–639, 660–668, 882–890. Desweiteren sei auf folgende Handbuchserien verwiesen: The Chemistry of Heterocyclic Compounds (A. Weissberger), Progress in Heterocyclic Chemistry (G. W. Gribble) und Advances in Heterocyclic Chemistry (A. R. Katritzky).

Weiterhin sei erwähnt: D. R. Shridhar et al. SYNTHESIS 1982, 986–987; Comprehensive Heterocyclic Chemistry Volume 4, 348–372 (1984) und Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Band, E6b2 915–1236, (1994)] hergestellt werden.

Im Fall, daß das unter A aufgeführte heterocyclische Ringsystem eine freie N-Funktion trägt, kann diese zunächst nach bekannten Alkylierungsmethoden alkyliert werden.

Die Verbindung der Formel (VIIa)



(IIa)

ist neu und kann hergestellt werden, indem man zunächst durch Umsetzung von 2-Amino-5-nitrobenzylalkohol und Thioharnstoff mit HBr unter Rückfluß und anschließender Alkalisch-Stellung 2-Amino-6-nitro-4H-benz-1,3-thiazin herstellt, und abschließend durch Erhitzen mit Chloracetaldehydlösung das Imidazol aufbaut. Der erste Schritt der Umsetzung erfolgt in einem Temperaturbereich von  $80$  bis  $110^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise bei  $100^{\circ}\text{C}$ . Die Umsetzung mit der Aldehydlösung erfolgt in einem Temperaturbereich von  $60^{\circ}\text{C}$  bis  $90^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise bei  $80^{\circ}\text{C}$ . Die Umsetzung mit Chloracetaldehydlösung erfolgt in Dimethylformamid oder Ethanol in einem Temperaturbereich von  $30^{\circ}\text{C}$  bis  $100^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise bei  $70^{\circ}\text{C}$ . Alle Reaktionsschritte werden bei Normaldruck durchgeführt.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (II) sind größtenteils neu und können wie oben beschrieben durch Reduktion der entsprechenden Nitroverbindungen der allgemeinen Formel (VII) hergestellt werden.

Der Aufbau der Ausgangsverbindungen der allgemeinen Formeln (II) und (VII) kann z. B. auch analog der in der EP-A-0738726 beschriebenen Herstellungsweise erfolgen.

Die Verbindungen der Formel (III) sind an sich bekannt und nach üblichen Verfahren herstellbar.

Die MHK-Werte wurden mit Hilfe der Mikrodilutionsmethode in BH-Medium bestimmt. Jede Prüfsubstanz wurde in DMSO gelöst. In der Mikrotiterplatte wurde durch serielle Verdünnung eine Konzentrationsreihe der Prüfsubstanzen angelegt. Zur Inokulation wurden Übernachtskulturen der Erreger verwandt, die zuvor im Nährmedium 1 : 250 verdünnt wurden. Zu  $100\ \mu\text{l}$  der verdünnten, wirkstoffhaltigen Nährlösungen wurden je  $100\ \mu\text{l}$  Inokulationslösung gegeben.

Die Mikrotiterplatten wurden bei  $37^{\circ}\text{C}$  bebrütet und nach ca. 20 Stunden oder nach 3 bis 5 Tagen abgelesen. Der MHK-Wert ( $\mu\text{g/ml}$ ) gibt die niedrigste Wirkstoffkonzentration an, bei der kein Wachstum zu erkennen war.

MHK-Werte ( $\mu\text{g/ml}$ )

Bsp.-Nr.	S. aureus 133
1 (Diastereomer 1 /Diastereomer 2 = 100:1)	1,5
2 (Diastereomer 1 /Diastereomer 2 = 100:1)	1

Die erfindungsgemäßen Verbindungen weisen bei geringer Toxizität ein breites antibakterielles Spektrum, speziell gegen gram-positive Keime und einige gram-negative Bakterien sowie Mycobacterien, Corynebakterien, Haemophilus influenzae und anaerobe Keime auf. Diese Eigenschaften ermöglichen ihre Verwendung als chemotherapeutische Wirkstoffe in der Human- und Tiermedizin.



Die erfindungsgemäßen Verbindungen sind gegen ein breites Spektrum von Mikroorganismen wirksam. Mit ihrer Hilfe können gram-positive Keime, gram-negative Bakterien und bakterienähnliche Mikroorganismen wie Mycoplasmen bekämpft sowie die durch diese Erreger hervorgerufenen Erkrankungen verhindert, gebessert und/oder geheilt werden.

Besonders wirksam sind die erfindungsgemäßen Verbindungen gegen Bakterien und bakterienähnliche Mikroorganismen. Sie sind daher besonders gut zur Prophylaxe und Chemotherapie von lokalen und systemischen Infektionen in der Human- und Tiermedizin geeignet, die durch solche Erreger hervorgerufen werden.

Zur vorliegenden Erfindung gehören pharmazeutische Zubereitungen, die neben nicht-toxischen, inerten, pharmazeutisch geeigneten Trägerstoffen eine oder mehrere erfindungsgemäße Verbindungen enthalten, oder die aus einem oder mehreren erfindungsgemäßen Wirkstoffen bestehen, sowie Verfahren zur Herstellung dieser Zubereitungen.

Der oder die Wirkstoffe können gegebenenfalls in einem oder mehreren der oben angegebenen Trägerstoffe auch in mikroverkapselter Form vorliegen.

Die therapeutisch wirksamen Verbindungen sollen in den oben aufgeführten pharmazeutischen Zubereitungen vorzugsweise in einer Konzentration von etwa 0,1 bis 99,5, vorzugsweise von etwa 0,5 bis 95 Gew.-% der Gesamtmischung, vorhanden sein.

Die oben aufgeführten pharmazeutischen Zubereitungen können außer den erfindungsgemäßen Verbindungen auch weitere pharmazeutische Wirkstoffe enthalten.

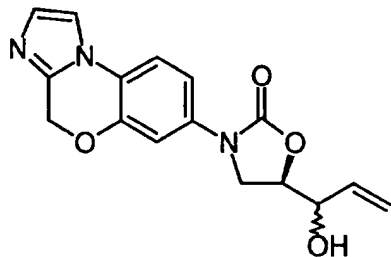
Im allgemeinen hat es sich sowohl in der Human- als auch in der Veterinärmedizin als vorteilhaft erwiesen, den oder die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Gesamtmengen von etwa 0,5 bis etwa 500, vorzugsweise 5 bis 100 mg/kg Körpergewicht je 24 Stunden, gegebenenfalls in Form mehrerer Einzelgaben, zur Erzielung der gewünschten Ergebnisse zu verabreichen. Eine Einzelgabe enthält den oder die erfindungsgemäßen Wirkstoffe vorzugsweise in Mengen von etwa 1 bis etwa 80, insbesondere 3 bis 30 mg/kg, Körpergewicht.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können zum Zweck der Erweiterung des Wirkungsspektrums und um eine Wirkungssteigerung zu erreichen, auch mit anderen Antibiotika kombiniert werden.

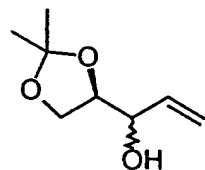
#### Beispiele

#### Beispiel 1

(5R)-N-(Imidazo[2,1-c]-1,4-benzoxazin-6-yl)-5-(1-hydroxy-2-propenyl)-1,3-oxazolidin-2-on (Diastereomer 1 und Diastereomer 2)



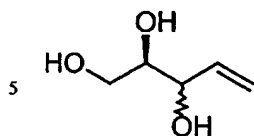
a) (2R)-1,2-O-Isopropyliden-4-penten-1,2,3-triol



Unter Argon werden bei  $-10^{\circ}\text{C}$  30.0 ml (29.56 mmol) einer 1.0-molaren Lösung von Vinylmagnesiumbromid in THF mit weiteren 10 ml wasserfreiem THF verdünnt und tropfenweise mit einer Lösung von 2.85 g (21.90 mmol) (2R)-2,3-O-Isopropyliden-2,3-hydroxypropanal in 20 ml THF versetzt. Das Kältebad wird entfernt und man läßt das Gemisch auf Raumtemperatur kommen. Nach 1.5 Stunden werden ca. 40 ml gesättigte Ammoniumchlorid-Lösung zugesetzt und das Produkt mit Essigester extrahiert. Die organische Phase wird nacheinander mit gesättigter Natriumhydrogencarbonat-Lösung, Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird das Lösemittel abrotiert. Es werden 2.41 g (15.23 mmol, 70% Ausbeute) einer farblosen Flüssigkeit erhalten. Laut NMR-Analyse liegt das Produkt als Diastereomerenmischung in einem Verhältnis von 59 zu 41 vor.

$R_f$ : 0.52 (Cyclohexan/Essigester, 1 : 1).  $^1\text{H-NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta/\text{ppm}$ ): 5.89–5.74 (1H, m), 5.42–5.22 (2H, m), 4.31–3.77 (4H, m), 2.44 und 2.23 (1H, 2d), 1.46 und 1.38 (6H, 2s). MS (EI, m/z): 143 ( $\text{M}^+-\text{CH}_3$ ).

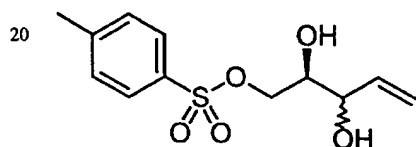
## b) (2R)-4-Penten-1,2,3-triol



Eine Lösung von 2.30 g (14.54 mmol) (2R)-1,2-O-Isopropyliden-4-penten-1,2,3-triol in 100 ml Methanol wird mit 1 ml konzentrierter Salzsäure versetzt. Nach 15 Stunden bei Raumtemperatur wird Amberlyst A-21 zugesetzt, 30 Minuten gerührt und filtriert. Das Filtrat wird vollständig vom Lösemittel befreit. Der Rückstand wird mit Essigester aufgenommen und auf eine Kieselgelnutsche aufgebracht. Nicht umgesetztes Startmaterial wird mit Essigester herausgewaschen. Das Produkt wird mit Methanol eluiert. Es werden 0.92 g (7.75 mmol, 53% Ausbeute) eines weissen Feststoffs erhalten.

R<sub>f</sub>: 0.38 (Cyclohexan/Essigester, 1 : 1). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>, δ/ppm): 5.98–5.85 (1H, m), 5.42–5.27 (2H, m), 4.31 und 4.21 (1H, 2 pseudo-quart), 3.81–3.60 (3H, m), 2.79 und 2.71 (1H, 2d), 2.47 und 2.43 (1H, 2d), 2.22 und 2.20 (1H, 2d). MS (EI, m/z): 87 (M<sup>+</sup>-CH<sub>2</sub>OH).

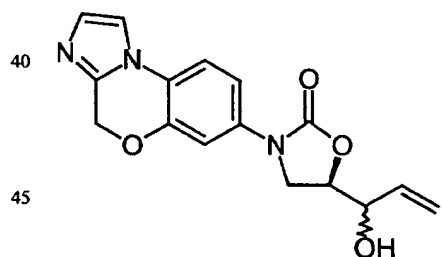
## c) ((2R)-2,3-Hydroxy-4-penten-1-yl)-para-toluolsulfonat



Eine Lösung von 900 mg (7.62 mmol) (2R)-4-Penten-1,2,3-triol in 20 ml wasserfreiem Dichlormethan wird mit 1.85 ml (22.86 mmol) Pyridin versetzt und auf 0°C abgekühlt. Bei dieser Temperatur werden portionsweise insgesamt 1.60 g (8.38 mmol) para-Toluolsulfonsäurechlorid zugesetzt. Man läßt über Nacht bei Raumtemperatur rühren. Anschließend wird mit 2-molarer Salzsäure, Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet. Das gewünschte Produkt wird in Form eines weissen Feststoffs nach Flash-Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester, 2 : 1) erhalten. 920 mg (3.38 mmol, 44% Ausbeute).

R<sub>f</sub>: 0.61 (Ethylacetat). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>, δ/ppm): 7.80 (2H, d), 7.37 (2H, d), 5.91–5.78 (1H, m), 5.37–5.22 (2H, m), 4.23–4.02 (3H, m), 3.88 und 3.79 (1H, 2 pseudo-quint), 2.68 (1H, s broad), 2.47 (3H, s), 2.32 (1H, s). MS (CI, NH<sub>3</sub>, m/z): 290 (M+NH<sub>4</sub><sup>+</sup>).

## d) (5R)-N-(Imidazo[2,1-c]-1,4-benzoxazin-6-yl)-5-(1-hydroxy-2-propenyl)-1,3-oxazolidin-2-on (Diastereomer 1 und Diastereomer 2)



0.62 ml (5.64 mmol) tert.-Amylalkohol werden in 6.0 ml Hexan gelöst vorgelegt und unter Argon bei -10°C mit 2.39 ml (3.82 mmol) einer 1.6-molaren Lösung von n-Butyllithium in Hexan versetzt. Nach 30 Minuten wird diese Lösung bei 0°C zu einer Lösung von 732 mg (1.82 mmol) Benzyl-N-(imidazo[2,1-c]-1,4-benzoxazin-6-yl)-carbammat in 2.5 ml N,N-Dimethylacetamid gegeben. Nach weiteren 30 Minuten bei 0°C werden 595 mg (2.19 mmol) ((2R)-2,3-Hydroxy-4-penten-1-yl)-para-toluolsulfonat (V. Jäger et al., Tetrahedron 47, 2195 (1991)) hinzugefügt und das Kältebad entfernt. Das Reaktionsgemisch wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Bei 0°C wird das Reaktionsgemisch mit 6 ml Methanol, 6 ml Wasser und 0.4 ml Eisessig versetzt. Es wird mit Dichlormethan verdünnt und nacheinander mit Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat wird das Lösemittel abrotiert. Der verbleibende Rückstand wird durch Flash-Chromatographie (Kieselgel, Dichlormethan/Methanol, 100 : 4) gereinigt. Das Produkt wird in Form eines weissen Feststoffs erhalten. 271 mg (0.86 mmol, 48% Ausbeute, Diastereomerenverhältnis 71 : 29).

Das Diastereomerengemisch wird durch präparative HPLC (Kromasil 100, NH-2, 5 µm; tert.-Butylmethylether/Methanol, 90 : 10) in seine Komponenten zerlegt. Es werden 118 mg des Diastereomers 1 und 35 mg des Diastereomers 2 in Form weisser amorpher Feststoffe erhalten.

Diastereomer 1 (Wirksameres Diastereomer):

Fp.: 227°C. R<sub>f</sub>: 0.20 (Dichlormethan/Methanol, 100 : 5). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>, δ/ppm): 7.92 (1H, d), 7.69 (1H, d), 7.48 (1H, d), 7.28 (1H, dd), 7.13 (1H, d), 5.88 (1H, ddd), 5.64 (1H, d), 5.42 (1H, ddd), S. 31 (2H, s), S. 26 (1H, ddd), 4.67 (1H, ddd), 4.32 (1H, pseudo-quart), 4.02 (1H, pseudo-t), 3.82 (1H, dd). MS (CI, m/z): 314 (M+H<sup>+</sup>).

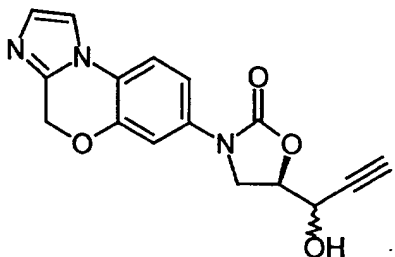
Diastereomer 2:

Fp.: 187°C. R<sub>f</sub>: 0.20 (Dichlormethan/Methanol, 100 : 5). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>, δ/ppm): 7.91 (1H, d), 7.70

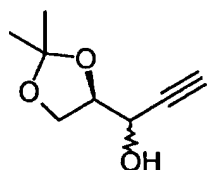
(1H, d), 7.44 (1H, d), 7.28 (1H, dd), 7.11 (1H, d), 5.88 (1H, ddd), 5.57 (1H, d), 5.39 (1H, ddd), 5.31 (2H, s), 5.22 (1H, ddd), 4.64 (1H, ddd), 4.20 (1H, pseudo-quart), 4.09 (1H, pseudo-t), 3.87 (1H, dd). MS (CI, m/z): 314 (M+H<sup>+</sup>).

## Beispiel 2

(5R)-N-(Imidazo[2,1-c]-1,4-benzoxazin-6-yl)-5-(1-hydroxy-2-propinyl)-1,3-oxazolidin-2-on (Diastereomer 1 und Diastereomer 2)



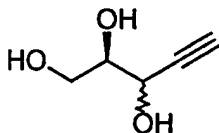
a) (2R)-1,2-O-Isopropyliden-4-pentin-1,2,3-triol (HAMI 391-1-1)



Unter Argon werden bei -10°C 71.5 ml (35.78 mmol) einer 0.5-molaren Lösung von Ethinylmagnesiumbromid in THF mit weiteren 10 ml wasserfreiem THF verdünnt und tropfenweise mit einer Lösung von 3.45 g (26.50 mmol) (2R)-2,3-O-Isopropyliden-2,3-hydroxypropanal in 40 ml THF versetzt. Das Kältebad wird entfernt und man läßt das Gemisch auf Raumtemperatur kommen. Nach 1.5 Stunden werden ca. 40 ml gesättigte Ammoniumchlorid-Lösung zugesetzt und das Produkt mit Essigester extrahiert. Die organische Phase wird nacheinander mit gesättigter Natriumhydrogencarbonat-Lösung, Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird das Lösemittel abrotiert. Es werden 3.45 g (22.06 mmol, 83% Ausbeute) einer farblosen Flüssigkeit erhalten. Laut GC- und NMR-Analyse liegt das Produkt als Diastereomergemisch in einem Verhältnis von 55 : 45 vor.

R<sub>f</sub>: 0.38 (Cyclohexan/Essigester, 1 : 1). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>, δ/ppm): 5.72 und 5.69 (1H, 2d), 4.22 und 4.10 (1H, 2 dt), 4.03–3.97 (2H, m), 3.82–3.74 (1H, m), 3.32 und 3.29 (1H, 2d), 1.33 und 1.27 (6H, d und s). MS (CI, NH<sub>3</sub>, nVz): 174 (M+NH<sub>4</sub><sup>+</sup>), 157 (M+H<sup>+</sup>).

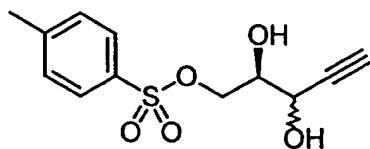
b) (2R)-4-Pentin-1,2,3-triol



Eine Lösung von 3.23 g (20.66 mmol) (2R)-1,2-O-Isopropyliden-4-pentin-1,2,3-triol in 150 ml Methanol wird mit 1 ml konzentrierter Salzsäure versetzt. Nach 15 Stunden bei Raumtemperatur wird Amberlyst A-21 zugesetzt, 30 Minuten gerührt und filtriert. Das Filtrat wird vollständig vom Lösemittel befreit. Es werden 2.36 g (20.32 mmol, 98% Ausbeute) eines weissen Feststoffs erhalten.

R<sub>f</sub>: 0.08 (Dichlormethan/Methanol, 100 : 10). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>, δ/ppm): 5.32 und 5.28 (1H, 2d), 4.81 und 4.80 (1H, 2d), 4.50 und 4.48 (1H, 2d), 4.17–4.11 (1H, m), 3.47–3.33 (3H, m), 3.21 und 3.19 (1H, 2d). MS (CI, NH<sub>3</sub>, m/z): 250 (2 · M+NH<sub>4</sub><sup>+</sup>), 134 (M+NH<sub>4</sub><sup>+</sup>).

c) ((2R)-2,3-Hydroxy-4-pentin-1-yl) para-toluolsulfonat



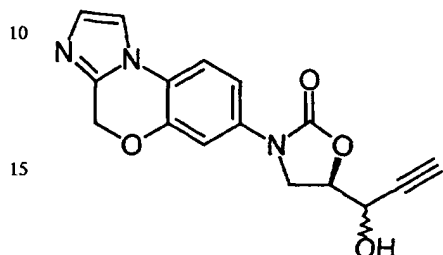
Eine Lösung von 2.32 g (19.95 mmol) (2R)-4-Pentin-1,2,3-triol (R. Brückner et al., Angew. Chem. 108, 1185 (1996).) in 20 ml wasserfreiem Dichlormethan wird mit 4.84 ml (59.86 mmol) Pyridin versetzt und auf 0°C abgekühlt. Bei dieser Temperatur werden portionsweise insgesamt 4.18 g (21.95 mmol) para-Toluolsulfonsäurechlorid zugesetzt. Man läßt über Nacht bei Raumtemperatur rühren. Anschließend wird mit 2-molarer Salzsäure, Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet. Das gewünschte Produkt wird in

Form eines weissen Feststoffs nach Flash-Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester, 1 : 1) erhalten. 1.76 g (6.51 mmol, 31% Ausbeute).

R<sub>f</sub>: 0.28 (Dichlormethan/Methanol, 100 : 5). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>, δ/ppm):

7.78 (2H, d), 7.47 (2H, d), 5.62 (1H, d), 5.49 (1H, d), 4.14–4.07 (2H, m), 3.94–3.86 (1H, m), 3.26 (1H, d), 2.41 (3H, s). MS (CI, NH<sub>3</sub>, m/z): 288 (2 · M+NH<sub>4</sub><sup>+</sup>), 558 (M+NH<sub>4</sub><sup>+</sup>).

d) (5R)-N-(Imidazo[2,1-c]-1,4-benzoxazin-6-yl)-5-(1-hydroxy-2-propinyl)-1,3-oxazolidin-2-on (Diastereomer 1 und Diastereomer 2)



0.81 ml (7.43 mmol) tert.-Amylalkohol werden in 7.7 ml Hexan gelöst vorgelegt und unter Argon bei –10°C mit 3.14 ml (5.02 mmol) einer 1.6-molaren Lösung von n-Butyllithium in Hexan versetzt. Nach 30 Minuten wird diese Lösung bei 0°C zu einer Lösung von 770 mg (2.40 mmol) Benzyl-N-(imidazo[2,1-c]-1,4-benzoxazin-6-yl)-carbammat in 3.3 ml N,N-Dimethylacetamid gegeben. Nach weiteren 30 Minuten bei 0°C werden 777.3 mg (2.87 mmol) ((2R)-2,3-Hydroxy-4-pentin-1-yl)-para-toluolsulfonat hinzugefügt und das Kältebad entfernt. Das Reaktionsgemisch wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Bei 0°C wird das Reaktionsgemisch mit 7.7 ml Methanol, 7.7 ml Wasser und 0.6 ml Eisessig versetzt. Es wird mit Dichlormethan verdünnt und nacheinander mit Wasser und gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat wird das Lösemittel abrotiert. Der verbleibende Rückstand wird durch Flash-Chromatographie (Kieselgel, Dichlormethan/Methanol, 100 : 4) gereinigt. Das Produkt wird in Form eines weissen Feststoffs erhalten. 384 mg (1.23 mmol, 52% Ausbeute, Diastereomerenverhältnis 52 : 48).

Das Diastereomerengemisch wird durch präparative HPLC (Kromasil 100, NH-2, 5 µm; tert.-Butylmethylether/Methanol, 90 : 10) in seine Komponenten zerlegt. Es werden 166 mg des Diastereomers 1 und 172 mg des Diastereomers 2 in Form weisser amorpher Feststoffe erhalten.

Diastereomer 1 (Wirksameres Diastereomer):

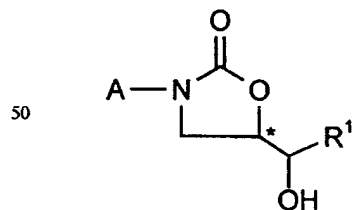
Fp.: 238°C (Zers.). R<sub>f</sub>: 0.07 (Dichlormethan/Methanol, 100 : 5). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>, δ/ppm): 7.90 (1H, d), 7.69 (1H, d), 7.47 (1H, d), 7.28 (1H, dd), 7.11 (1H, d), 6.13 (1H, d), 5.30 (2H, s), 4.71 (1H, ddd), 4.53 (1H, ddd), 4.18 (1H, pseudo-t), 3.91 (1H, dd), 3.48 (1H, d). MS (CI, NH<sub>3</sub>, m/z): 312 (M+H<sup>+</sup>).

Diastereomer 2:

Fp.: 249°C (Zers.). R<sub>f</sub>: 0.07 (Dichlormethan/Methanol, 100 : 5). <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>, δ/ppm): 7.90 (1H, d), 7.69 (1H, d), 7.46 (1H, d), 7.27 (1H, dd), 7.12 (1H, d), 6.12 (1H, s broad), 5.31 (2H, s), 4.69 (1H, pseudo-quint), 4.52 (1H, dd), 4.17 (1H, pseudo-t), 3.90 (1H, dd), 3.41 (1H, d). MS (CI, NH<sub>3</sub>, m/z): 312 (M+H<sup>+</sup>).

#### Patentansprüche

1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



(I)

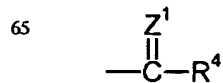
in welcher

R<sup>1</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen ist, das gegebenenfalls mit 1 bis 3 Substituenten substituiert ist, die aus der Gruppe ausgewählt werden, die besteht aus Halogen, Cyano, Hydroxy, geradkettigem oder verzweigtem Alkoxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Mercapto, geradkettigem oder verzweigtem Alkylthio mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen und -NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, worin

R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> Wasserstoff bedeuten, oder

R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet, und

R<sup>3</sup> einen Rest der Formeln



bedeutet, worin

Z<sup>1</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,

R<sup>4</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen oder Trifluormethyl bedeutet, oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Halogen oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist, oder

Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen 5- bis 6-gliedrigen gesättigten oder aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, wobei die unter R<sup>4</sup> aufgeführten Ringsysteme gegebenenfalls bis zu 2-fach gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy oder Phenyl substituiert sind, oder

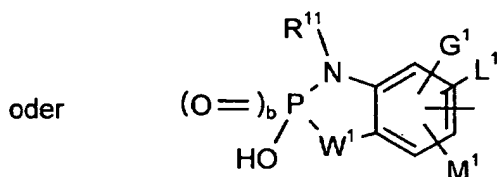
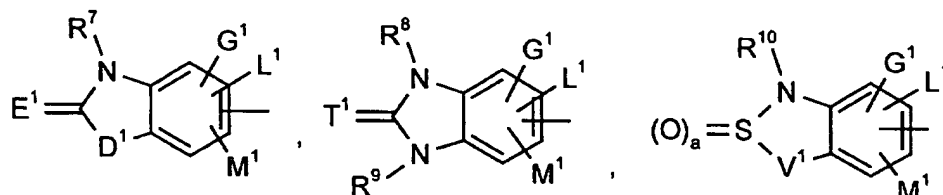
R<sup>4</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenoxy, Benzyloxy, Carboxyl, Halogen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder durch einen 5-bis 6-gliedrigen Heterocyclus aus der Reihe S, N und/oder O substituiert ist, oder

R<sup>4</sup> einen Rest der Formel -NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> bedeutet, worin

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl, Pyridyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch über N-gebundenes Morpholin substituiert ist, oder

R<sup>1</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen; geradkettiges oder verzweigtes Alkynyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen; geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen; Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder -CONR<sup>2</sup>R<sup>3</sup> ist, worin R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebene Bedeutungen von R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> aufweisen, oder

A für einen Rest der Formeln

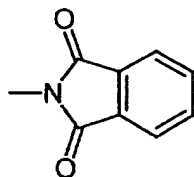


steht, worin

G<sup>1</sup>, L<sup>1</sup> und M<sup>1</sup> gleich oder verschieden sind und für Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder für eine Gruppe der Formel -CO-NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> stehen, worin

R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten,

R<sup>7</sup> Wasserstoff, Cycloalkylcarbonyl oder Cycloalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Cyano, Azido, Trifluormethyl, Pyridyl, Halogen, Hydroxy, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder durch eine Gruppe der Formel -(CO)<sub>c</sub>-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>-N-SO<sub>2</sub>-R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>-N-SO<sub>2</sub>-, R<sup>20</sup>-S(O)<sub>d</sub> oder



substituiert ist, worin

c eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup>, die oben angegebene Bedeutung von R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

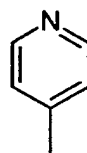
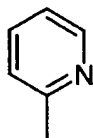
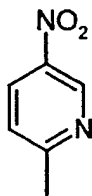
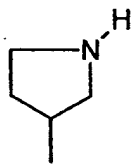
oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6-gliedrigen, gesättigten Heterocyclus mit gegebenenfalls einem weiteren Heteroatom aus der Serie N, S und/oder O bilden, der seinerseits gegebenenfalls, auch an einem weiteren Stickstoffatom, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

d eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

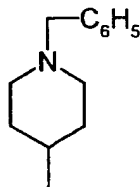
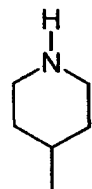
R<sup>17</sup> und R<sup>20</sup> gleich oder verschieden sind und geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen,

Benzyl, Phenyl oder TolyI bedeuten,  
oder  $R^7$  einen Rest der Formeln

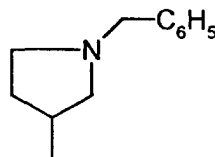
5



10



oder



15

20

bedeutet oder

$R^7$  eine Gruppe der Formel  $-\text{COCl}_3$  oder geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{CCl}_3$  oder eine Gruppe der Formel  $-\text{OR}^{21}$  substituiert ist, worin

$R^{21}$  Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Aryl mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist, oder

25

$R^7$  eine Gruppe der Formel  $-(\text{CO})_c-\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$ ,  $-\text{NR}^{24}-\text{SO}_2\text{R}^{25}$ ,  $\text{R}^{27}\text{R}^{26}\text{N}-\text{SO}_2$  oder  $\text{R}^{28}-\text{S}(\text{O})_f$  bedeutet, worin  $c$  die oben angegebene Bedeutung von  $c$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,  $R^{22}$ ,  $R^{23}$  und  $R^{24}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{14}$ ,  $R^{15}$  und  $R^{16}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

30

$R^{26}$  und  $R^{27}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{12}$  und  $R^{13}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

f

die oben angegebene Bedeutung von  $d$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

$R^{25}$  und  $R^{28}$  die oben angegebene Bedeutungen von  $R^{17}$  und  $R^{19}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

$D^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,

$E^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel  $\text{NH}$  bedeutet,

$T^1$  ein Sauerstoffatom oder die  $\text{NH}$ -Gruppe bedeutet,

35

$R^8$  und  $R^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder

$T^1$  ein Schwefelatom bedeutet,

mit der Maßgabe, daß  $R^8$  und  $R^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben, aber nicht für Wasserstoff stehen,

oder im Fall, daß  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  nicht für Wasserstoff stehen,  $E^1$  und/oder  $T^1$  eine Gruppe der Formel  $\text{NR}^{29}$  bedeuten,

worin  $R^{29}$  mit Ausnahme von Wasserstoff die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

40

oder  $R^{29}$  Cyano oder eine Gruppe der Formel  $-\text{CO}_2\text{R}^{30}$  bedeutet, worin

$R^{30}$  Benzyl oder Phenyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Nitro oder Halogen substituiert sind

$V^1$  und  $W^1$  die oben angegebene Bedeutung von  $D^1$  haben oder die oben aufgeführte Gruppe  $\text{N}-\text{R}^9$  bedeuten und mit dieser gleich oder verschieden sind,

45

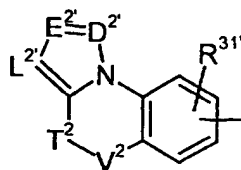
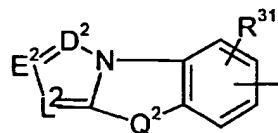
$a$  eine Zahl 1 oder 2 bedeutet,

$b$  eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

$R^{10}$  und  $R^{11}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder

$A$  für Reste der Formeln

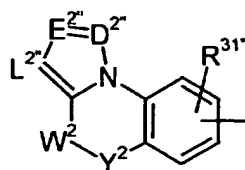
50



55

60

oder



steht,

65

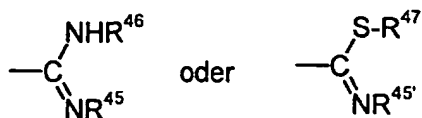
worin

$R^{31}$ ,  $R^{31'}$  und  $R^{31''}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Halogen bedeuten,

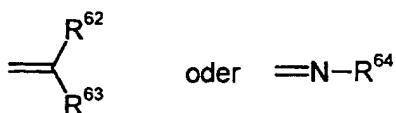
$D^2$ ,  $D^2'$  und  $D^2''$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $\text{CR}^{32}$  bedeuten, wo-

rin

R<sup>32</sup> Wasserstoff, Trifluormethyl, Halogen, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel -NR<sup>33</sup>R<sup>34</sup> bedeutet, worin  
 R<sup>33</sup> und R<sup>34</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten,  
 E<sup>2</sup>, E<sup>2'</sup> und E<sup>2''</sup> gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel CR<sup>35</sup> bedeuten, worin  
 R<sup>35</sup> Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano oder Halogen bedeutet, oder  
 geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sind, oder  
 Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, wobei die Ringsysteme gegebenenfalls bis zu 3-fach gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Trifluormethyl substituiert sind, oder  
 R<sup>35</sup> Reste der Formeln O-R<sup>36</sup>, -CO-R<sup>37</sup> oder NR<sup>38</sup>R<sup>39</sup> bedeutet, worin  
 R<sup>36</sup> Wasserstoff, Benzoyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet,  
 R<sup>37</sup> Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, oder  
 R<sup>37</sup> eine Gruppe der Formel -NR<sup>40</sup>R<sup>41</sup> bedeutet, worin  
 R<sup>40</sup> und R<sup>41</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten,  
 R<sup>38</sup> und R<sup>39</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Benzyl, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder eine Gruppe der Formel -CO<sub>2</sub>R<sup>42</sup> oder -CM<sup>2</sup>-NR<sup>43</sup>R<sup>44</sup> bedeuten, worin  
 R<sup>42</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet,  
 M<sup>2</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,  
 R<sup>43</sup> und R<sup>44</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>33</sup> und R<sup>34</sup> haben, oder  
 R<sup>38</sup> Wasserstoff bedeutet und  
 R<sup>39</sup> einen Rest der Formel



bedeutet, worin  
 R<sup>45</sup> und R<sup>45'</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten,  
 R<sup>46</sup> und R<sup>47</sup> gleich oder verschieden sind und geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Phenyl oder Benzyl bedeuten,  
 L<sup>2</sup>, L<sup>2'</sup> und L<sup>2''</sup> gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel CR<sup>48</sup> bedeuten, worin  
 R<sup>48</sup> Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano, Halogen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl oder durch einen Rest der Formel -OR<sup>49</sup> substituiert ist, worin  
 R<sup>49</sup> Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet, oder  
 R<sup>48</sup> Reste der Formeln -OR<sup>50</sup>, -COR<sup>51</sup> oder -NR<sup>52</sup>R<sup>53</sup> bedeutet, worin  
 R<sup>50</sup> Wasserstoff, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,  
 R<sup>51</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>39</sup> hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,  
 R<sup>52</sup> und R<sup>53</sup> die oben angegebene Bedeutung von und R<sup>34</sup> haben und mit diesen gleich oder verschieden sind, oder  
 R<sup>52</sup> Wasserstoff bedeutet und  
 R<sup>53</sup> Cyano oder einen Rest der Formel -CO-NR<sup>54</sup>R<sup>55</sup> oder -CS-NR<sup>56</sup>R<sup>57</sup> bedeutet, worin  
 R<sup>54</sup>, R<sup>55</sup>, R<sup>56</sup> und R<sup>57</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>35</sup> und R<sup>36</sup> haben, oder  
 R<sup>52</sup> und R<sup>53</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6-gliedrigen, gesättigten Heterocyclus bilden, der noch ein weiteres Heteroatom aus der Reihe S, O oder einen Rest der Formel -NH enthalten kann,  
 Q<sup>2</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder Reste der Formeln SO<sub>2</sub>, SO, C=O oder CR<sup>58</sup>R<sup>59</sup> bedeutet, worin  
 R<sup>58</sup> und R<sup>59</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Halogen bedeuten,  
 T<sup>2</sup> einen Rest der Formel CR<sup>60</sup>R<sup>61</sup> bedeutet, worin  
 R<sup>60</sup> und R<sup>61</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyloxy bedeuten, oder  
 R<sup>60</sup> und R<sup>61</sup> gemeinsam Reste der Formeln =O, =S,



bilden, worin

$\text{R}^{62}$  und  $\text{R}^{63}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten, oder

$\text{R}^{62}$  und  $\text{R}^{63}$  gemeinsam einen 3- bis 6-gliedrigen, gesättigten oder partiell ungesättigten Carbocyclus bilden, und  $\text{R}^{64}$  Wasserstoff, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

$\text{V}^2$  ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom oder einen Rest der Formel  $\text{SO}$  oder  $\text{SO}_2$  bedeutet,

$\text{W}^2$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet, oder Reste der Formeln  $\text{C}=\text{O}$ ,  $\text{C}=\text{S}$ ,  $\text{SO}$ ,  $\text{SO}_2$ ,  $\text{NR}^{65}$  oder  $\text{CR}^{66}\text{R}^{67}$  bedeutet, worin

$\text{R}^{65}$  die oben angegebene Bedeutung von  $\text{R}^{64}$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

$\text{R}^{66}$  und  $\text{R}^{67}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten, oder

$\text{R}^{66}$  Wasserstoff bedeutet und

$\text{R}^{67}$  einen Rest der Formel  $-\text{OR}^{68}$  bedeutet, worin

$\text{R}^{68}$  Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet,

$\text{Y}^2$  einen Rest der Formel  $\text{C}=\text{O}$  oder  $-\text{CR}^{69}\text{R}^{70}$  bedeutet, worin

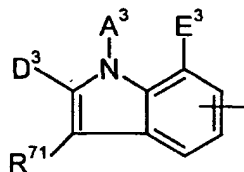
$\text{R}^{69}$  und  $\text{R}^{70}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Halogen, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder

$\text{R}^{69}$  Wasserstoff bedeutet und

$\text{R}^{70}$  Hydroxy, Benzyloxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, oder

$\text{W}^2$  und  $\text{Y}$  gemeinsam für die Gruppe  $-\text{CH}=\text{CH}-$  stehen, oder

$\text{A}$  für einen Rest der Formel

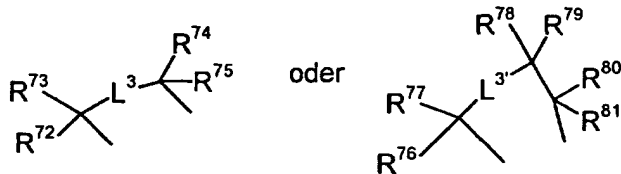


steht, in welcher

$\text{R}^{71}$  für Wasserstoff, Halogen oder für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen steht,

$\text{E}^3$  für Wasserstoff oder für Halogen steht,

$\text{A}^3$  und  $\text{D}^3$  gemeinsam unter Einbezug des Stickstoffatoms einen heterocyclischen Rest der Formel



bilden, worin

$\text{L}^3$  und  $\text{L}^{3'}$  gleich oder verschieden sind und ein Sauerstoffatom oder einen Rest der Formel  $-\text{NR}^{82}$  bedeuten, worin  $\text{R}^{82}$  Wasserstoff, Carboxyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, oder

geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel  $-\text{NR}^{83}\text{R}^{84}$  substituiert ist, worin

$\text{R}^{83}$  und  $\text{R}^{84}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder

geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, die gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy-carbonyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel  $-\text{NR}^{83}\text{R}^{84}$  substituiert sind, worin

$\text{R}^{83}$  und  $\text{R}^{84}$  die oben angegebene Bedeutung von  $\text{R}^{83}$  und  $\text{R}^{84}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, und/oder Alkyl oder Alkenyl gegebenenfalls durch Aryl mit 6 bis 14 Kohlenstoffatomen substituiert sind, das seinerseits durch Halogen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

$\text{R}^{72}$ ,  $\text{R}^{73}$ ,  $\text{R}^{74}$  und  $\text{R}^{75}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch Halogen substituiert ist, oder

$\text{R}^{72}$  und  $\text{R}^{73}$  und/oder  $\text{R}^{74}$  und  $\text{R}^{75}$  gemeinsam Reste der Formel  $=\text{O}$ , oder  $=\text{S}$  bilden,

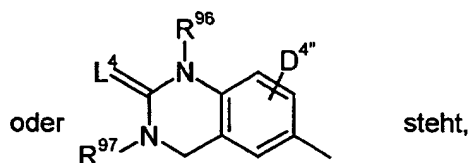
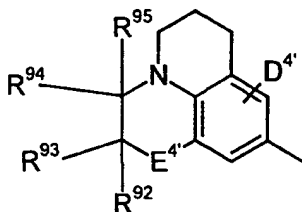
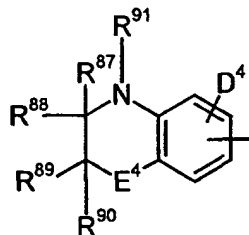


$R^{76}$ ,  $R^{77}$ ,  $R^{78}$ ,  $R^{79}$ ,  $R^{80}$  und  $R^{81}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel  $-NR^{85}R^{86}$  substituiert ist, worin

$R^{85}$  und  $R^{86}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{83}$  und  $R^{84}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder

$R^{76}$  und  $R^{77}$  und/oder  $R^{78}$  und  $R^{79}$  und/oder  $R^{80}$  und  $R^{81}$  gemeinsam Reste der Formel  $=O$  oder  $=S$  bilden und/oder  $R^{79}$  und  $R^{80}$  gemeinsam eine endocyclische Doppelbindung bilden, oder

A für Reste der Formeln



worin

$D^4$ ,  $D^4'$  und  $D^4''$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten,

$E^4$  und  $E^4'$  gleich oder verschieden sind und eine  $-CH_2-$ Gruppe, ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder einen Rest der Formel  $-SO$  oder  $-SO_2$  bedeuten,

$L^4$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel  $=NR^{98}$  bedeutet, worin

$R^{98}$  Wasserstoff, Phenyl, Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

$R^{87}$ ,  $R^{88}$ ,  $R^{89}$ ,  $R^{90}$ ,  $R^{92}$ ,  $R^{93}$ ,  $R^{94}$  und  $R^{95}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, die gegebenenfalls durch Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder durch einen 5- bis 6-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O substituiert sind, die ihrerseits ein- bis mehrfach durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Alkyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Hydroxy oder Halogen substituiert sein können, oder

$R^{87}$  und  $R^{88}$ ,  $R^{89}$  und  $R^{90}$ ,  $R^{92}$  und  $R^{93}$  und/oder  $R^{94}$  und  $R^{95}$  gemeinsam Gruppen der Formel  $=O$ ,  $=CH_2$  oder  $=CHR^{99}$  bilden, worin

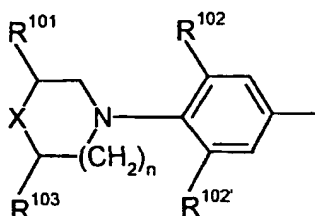
$R^{99}$  Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen 5- bis 7-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O bedeutet, wobei die Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach durch Halogen, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind,

$R^{91}$ ,  $R^{96}$  und  $R^{97}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder

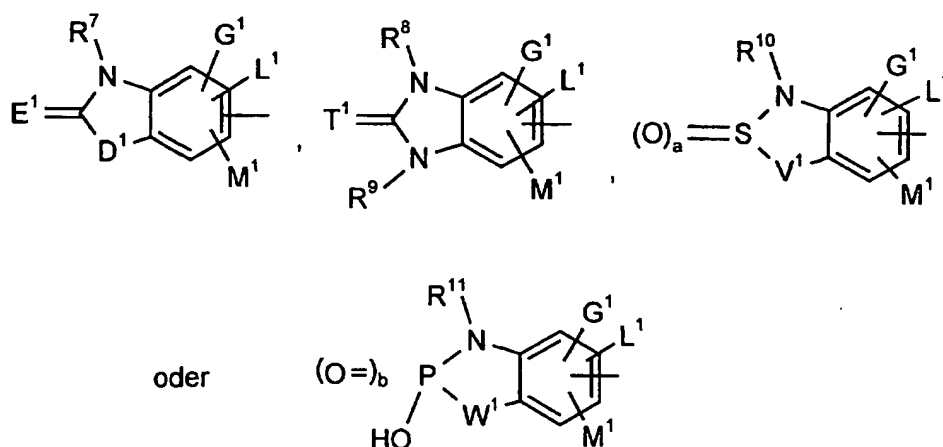
einen Rest der Formel  $-CO-R^{100}$  bedeuten, worin

$R^{100}$  Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, ein 5- bis 7-gliedriger aromatischer Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist, wobei die unter  $R^{100}$  aufgeführten Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Trifluormethyl, Nitro, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind, oder

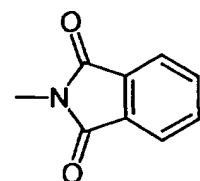
A eine Gruppe der Formel



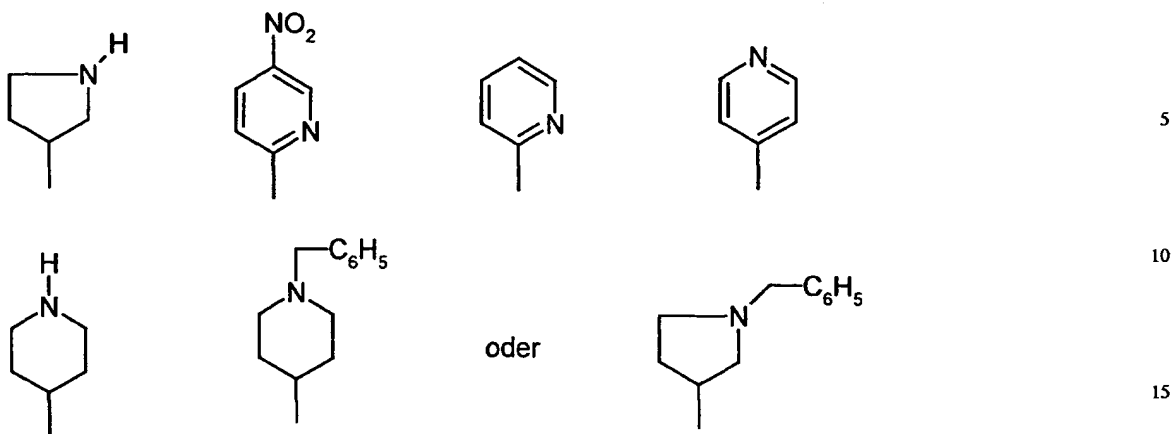
- 5 worin X O, S, SO, SO<sub>2</sub>, S(O)NR<sup>104</sup> oder S(O)<sub>2</sub>NR<sup>104</sup> ist;  
 worin R<sup>104</sup> Wasserstoff, wahlweise durch ein bis drei Substituenten ausgewählt aus Chlor, Fluor, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, Amino und Mono- oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylamino substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl oder p-Toluolsulfonyl ist, R<sup>101</sup> Wasserstoff ist, und,  
 wenn X O ist, R<sup>101</sup> Wasserstoff -CH<sub>3</sub>, -CN, -CO<sub>2</sub>H, -CO<sub>2</sub>R<sup>105</sup>, worin  
 15 R<sup>105</sup> Wasserstoff, wahlweise durch ein bis drei Substituenten ausgewählt aus Chlor, Fluor, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Acyloxy und -OCH<sub>2</sub>-Ph substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)Cycloalkyl, Amino, Mono- oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkylamino oder (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkoxy ist, oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>g</sub>R<sup>106</sup> ist, worin g 1 oder 2 und R<sup>106</sup> Wasserstoff, -OR<sup>105</sup>, -OCOR<sup>105</sup>, -NH<sub>2</sub>, -NHCOR<sup>105</sup> oder -N(R<sup>104</sup>)<sub>2</sub> ist, worin R<sup>105</sup> und R<sup>106</sup>, die oben angegebenen Bedeutungen aufweisen, und R<sup>102</sup> und R<sup>102'</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Chlor oder Fluor bedeuten,  
 20 R<sup>103</sup> Wasserstoff oder Methyl ist,  
 n 0, 1 oder 2 ist  
 und tautomere Formen und/oder Salze davon.  
 2. Verbindungen nach Anspruch 1, worin A für einen Rest der Formeln



- 35 steht,  
 worin G<sup>1</sup>, L<sup>1</sup> und M<sup>1</sup> für Wasserstoff stehen,  
 R<sup>7</sup> Wasserstoff, Cyclopropylcarbonyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, die gegebenenfalls durch Cyano, Azido, Trifluormethyl, Pyridyl, Fluor, Chlor, Brom, Pyridyl, Hydroxy, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Benzyloxy carbonyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, und/oder durch eine Gruppe der Formel  
 50 -(CO)c-NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>-N-SO<sub>2</sub>R<sup>17</sup>, R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>-N-SO<sub>2</sub>-, R<sup>20</sup>-S(O)<sub>d</sub> oder



- 55 substituiert ist,  
 c eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,  
 worin R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, R<sup>18</sup> und R<sup>19</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Methyl oder Ethyl bedeuten,  
 d eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,  
 R<sup>17</sup> und R<sup>20</sup> gleich oder verschieden sind und geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, Benzyl, Phenyl oder Tolyll bedeuten,  
 65 oder R<sup>7</sup> einen Rest der Formeln



bedeutet oder

$R^7$  eine Gruppe der Formel  $-\text{COCl}_3$  oder geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{CCl}_3$  oder eine Gruppe der Formel  $-\text{OR}^{21}$  substituiert ist, worin

$R^{21}$  Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl substituiert ist, oder

$R^7$  eine Gruppe der Formel  $-(\text{CO})_e-\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$  oder  $\text{R}^{28}-\text{S}(\text{O})_f$  bedeutet, worin

$e$  die Zahl 1 ist,

$R^{22}$  und  $R^{23}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Methyl oder Ethyl bedeuten,

$f$  die oben angegebene Bedeutung von  $d$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

$R^{28}$  Methyl, Phenyl, Toly1 oder Benzyl bedeutet,

$\text{D}^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,

$\text{E}^1$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel  $\text{NH}$  bedeutet,

$\text{T}^1$  ein Sauerstoffatom oder die  $\text{NH}$ -Gruppe bedeutet,

$\text{R}^8$  und  $\text{R}^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $\text{R}^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder

$\text{T}^1$  ein Schwefelatom bedeutet,

mit der Maßgabe, daß  $\text{R}^8$  und  $\text{R}^9$  die oben angegebene Bedeutung von  $\text{R}^7$  haben, aber nicht für Wasserstoff stehen, oder im Fall, daß  $\text{R}^7$ ,  $\text{R}^8$  und  $\text{R}^9$  nicht für Wasserstoff stehen,  $\text{E}^1$  und/oder  $\text{T}^1$  eine Gruppe der Formel  $\text{NR}^{29}$  bedeuten, worin  $\text{R}^{29}$  mit Ausnahme von Wasserstoff die oben angegebene Bedeutung von  $\text{R}^7$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

oder  $\text{R}^{29}$  Cyano oder eine Gruppe der Formel  $-\text{CO}_2\text{R}^{30}$  bedeutet, worin

$\text{R}^{30}$  Benzyl oder Phenyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Nitro oder Halogen substituiert sind;

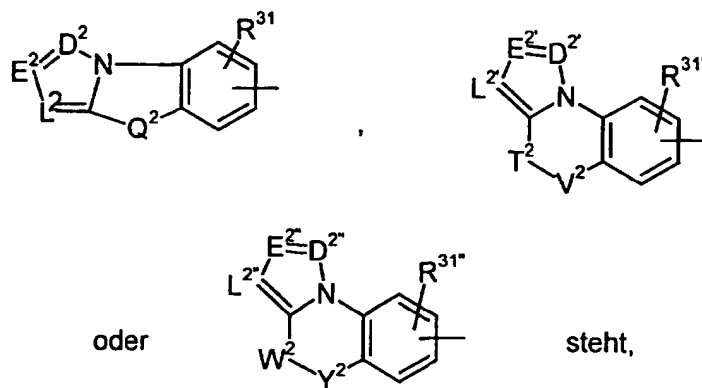
$\text{V}^1$  und  $\text{W}^1$  die oben angegebene Bedeutung von  $\text{D}^1$  haben oder die oben aufgeführte Gruppe  $\text{N}-\text{R}^9$  bedeuten und mit dieser gleich oder verschieden sind,

$a$  eine Zahl 1 oder 2 bedeutet,

$b$  eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

$\text{R}^{10}$  und  $\text{R}^{11}$  die oben angegebene Bedeutung von  $\text{R}^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, und tautomere Formen und/oder Salze davon.

3. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß A ausgewählt wird aus der Gruppe der Formeln:



worin

$\text{R}^{31}$ ,  $\text{R}^{31'}$  und  $\text{R}^{31''}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Fluor bedeuten,

$\text{D}^2$ ,  $\text{D}^{2'}$  und  $\text{D}^{2''}$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $\text{CR}^{32}$  bedeuten, worin

$\text{R}^{32}$  Wasserstoff, Trifluormethyl, Chlor, Fluor, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet,

$E^2$ ,  $E^{2'}$  und  $E^{2''}$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $CR^{35}$  bedeuten, worin

$R^{35}$  Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Hydroxy substituiert sind, oder

Phenyl, Naphtyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Pyrazinyl, Thienyl oder Furyl bedeutet, oder

$R^{35}$  Reste der Formeln  $O-R^{36}$ ,  $-CO-R^{37}$  oder  $-NR^{38}R^{39}$  bedeutet, worin

$R^{36}$  Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet,

$R^{37}$  Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet, oder

$R^{37}$  eine Gruppe der Formel  $-NR^{40}R^{41}$  bedeutet, worin

$R^{40}$  und  $R^{41}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeuten,

$R^{38}$  und  $R^{39}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Benzyl, Phenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen oder eine Gruppe der Formel  $-CO_2R^{42}$  bedeuten, worin

$R^{42}$  geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen, Benzyl oder Phenyl bedeutet,

$L^2$ ,  $L^{2'}$  und  $L^{2''}$  gleich oder verschieden sind und ein Stickstoffatom oder einen Rest der Formel  $CR^{48}$  bedeuten, worin

$R^{48}$  Wasserstoff, Trifluormethyl, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl oder durch einen Rest der Formel  $-OR^{49}$  substituiert ist, worin

$R^{49}$  Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet, oder

$R^{48}$  Reste der Formeln  $-OR^{50}$ ,  $-COR^{51}$  oder  $-NR^{52}R^{53}$  bedeutet, worin

$R^{50}$  Wasserstoff, Phenyl, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet,

$R^{51}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{39}$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

$R^{52}$  und  $R^{53}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{33}$  und  $R^{34}$  haben und mit diesen gleich oder verschieden sind,

$Q^2$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder Reste der Formeln  $SO_2$ ,  $SO$ ,  $C=O$  oder  $CR^{58}R^{59}$  bedeutet, worin

$R^{58}$  und  $R^{59}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Fluor bedeuten,

$T^2$  einen Rest der Formel  $-CR^{60}R^{61}$  bedeutet, worin

$R^{60}$  und  $R^{61}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Fluor, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen oder Benzyloxy bedeuten, oder

$R^{60}$  und  $R^{61}$  gemeinsam Reste der Formeln  $=O$  oder  $=S$  bilden,

$V^2$  ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom oder einen Rest der Formel  $SO$  oder  $SO_2$  bedeutet,

$W^2$  ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet, oder Reste der Formeln  $C=O$ ,  $C=S$ ,  $SO$ ,  $SO_2$ ,  $NR^{65}$  oder  $CR^{66}R^{67}$  bedeutet, worin

$R^{65}$  Wasserstoff, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet,

$R^{66}$  und  $R^{67}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Fluor, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeuten, oder

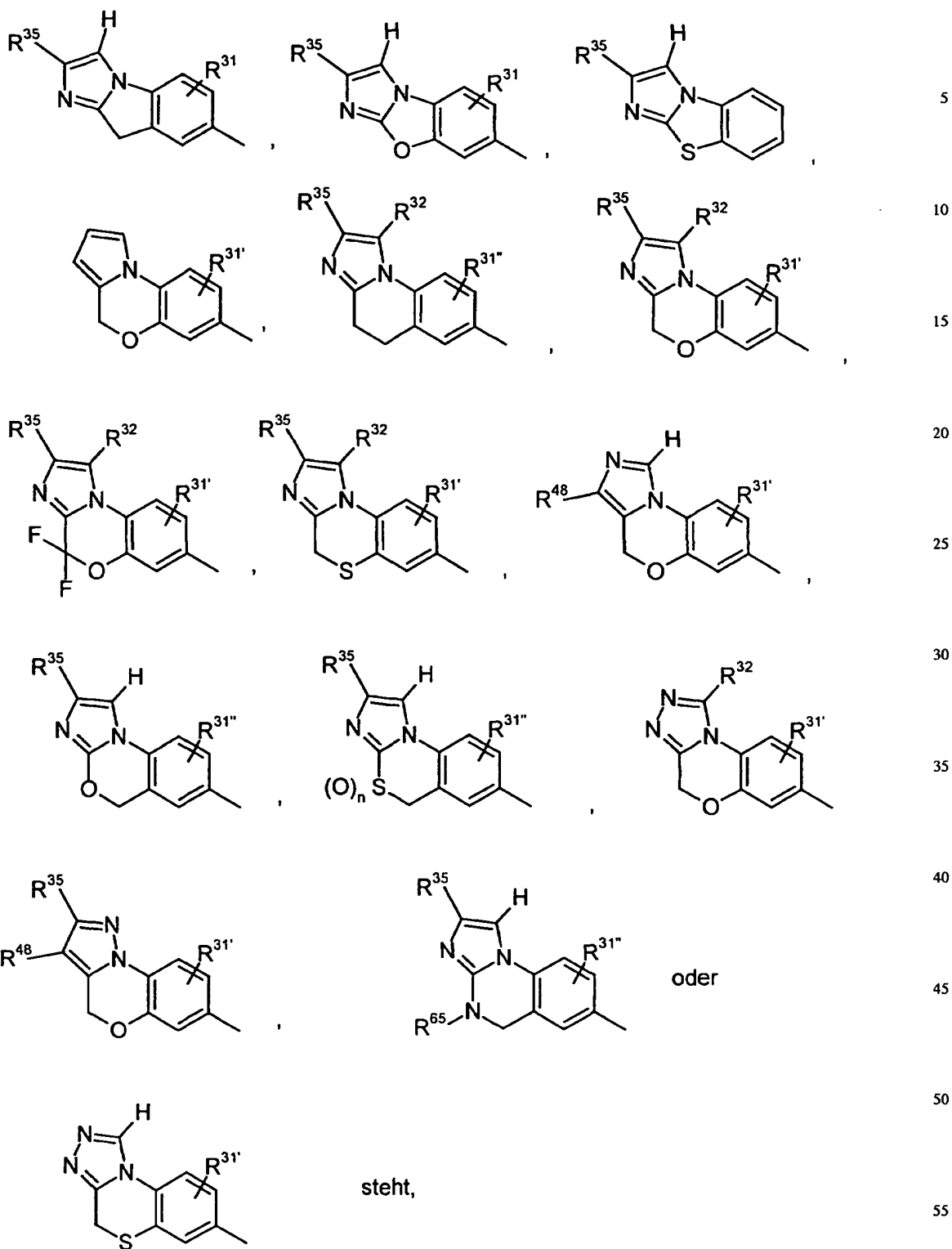
$Y^2$  einen Rest der Formel  $C=O$  oder  $-CR^{69}R^{70}$  bedeutet, worin

$R^{69}$  und  $R^{70}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Fluor, Benzyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten,

und tautomere Formen und/oder Salze davon.

4. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 3, worin

A für Reste der Formeln



worin

$n$  eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

$R^{31}$ ,  $R^{31'}$  und  $R^{31''}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder Fluor bedeuten,

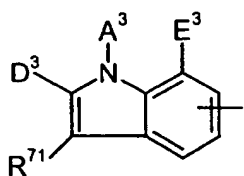
$R^{32}$  und  $R^{48}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder für Methyl stehen,

$R^{35}$  für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Trifluormethyl, Phenyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy-carbonyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen steht,

$R^{65}$  Wasserstoff oder Methyl bedeutet,

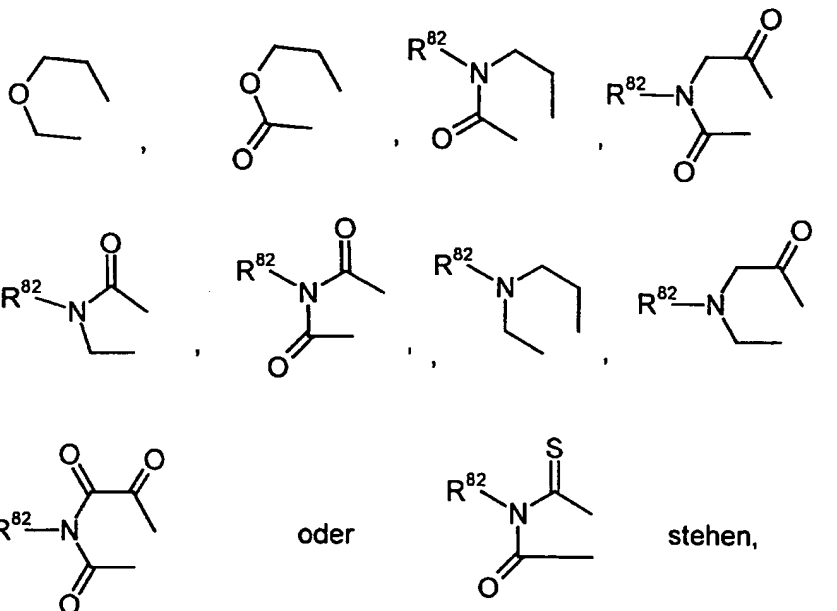
und tautomere Formen und/oder Salze davon.

5. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, worin A für einen Rest der Formel



steht, in welcher

A³ und D³ gemeinsam unter Einbezug des Stickstoffatoms einen heterocyclischen Rest der Formel



in welcher

R⁸² Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Cyano, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Amino, N,N-Dimethylamino oder durch Phenyl substituiert ist, oder

geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Hydroxy, Amino oder N,N-Dimethylamino substituiert ist, oder Methoxycarbonyl bedeutet,

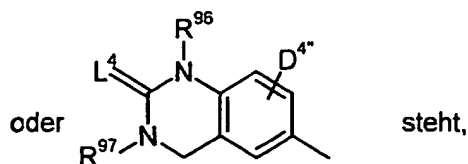
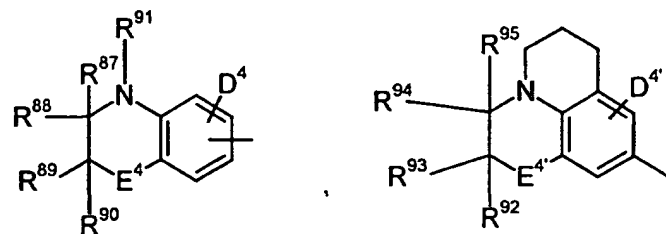
E für Wasserstoff oder Fluor steht,

R⁷¹ für Wasserstoff, Fluor steht,

und tautomere Formen und/oder Salze davon.

6. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, in welchen

A für Reste der Formeln



worin

D⁴, D⁴' und D⁴'' gleich oder verschieden sind und Wasserstoff bedeuten,

E⁴ und E⁴' gleich oder verschieden sind und die -CH₂-Gruppe, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder einen Rest

der Formel -SO oder -SO<sub>2</sub> bedeuten,

L<sup>4</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel -NR<sup>98</sup> bedeutet, worin

R<sup>98</sup> Wasserstoff, Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeutet, R<sup>87</sup>, R<sup>88</sup>, R<sup>89</sup>, R<sup>90</sup>, R<sup>92</sup>, R<sup>93</sup>, R<sup>94</sup> und R<sup>95</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch Phenyl oder Naphthyl substituiert ist, die ihrerseits ein- bis mehrfach durch Methoxy, Fluor oder Chlor substituiert sein können,

R<sup>87</sup> und R<sup>88</sup>, R<sup>89</sup> und R<sup>90</sup>, R<sup>92</sup> und R<sup>93</sup> und/oder R<sup>94</sup> und R<sup>95</sup> gemeinsam Gruppen der Formel = O, =CH<sub>2</sub> oder =CHR<sup>99</sup> bilden, worin

R<sup>99</sup> Phenyl oder Pyridyl bedeutet, wobei die Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach durch Fluor, Chlor, oder durch Methoxy substituiert sind,

R<sup>91</sup>, R<sup>96</sup> und R<sup>97</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy-carbonyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder

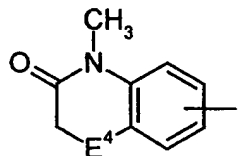
einen Rest der Formel -CO-R<sup>100</sup> bedeuten, worin

R<sup>100</sup> Phenyl, Naphthyl, Pyridyl, Thienyl, Furyl, Imidazolyl, Pyridazolyl, Pyrimidyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Phenyl oder Naphthyl substituiert ist, wobei die unter R<sup>15</sup> aufgeführten Ringsysteme gegebenenfalls ein- bis mehrfach gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, Nitro, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen substituiert sind,

sowie tautomere Formen und/oder Salze davon.

7. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 6, in welchen

A für einen Rest der Formel

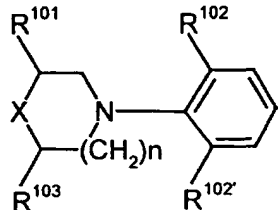


steht, worin

E<sup>4</sup> ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet, oder die CH<sub>2</sub>-Gruppe bedeutet,

und Tautomere und/oder Salze davon.

8. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1, worin A eine Gruppe der Formel



ist, worin

X O ist;

R<sup>101</sup> und R<sup>103</sup> Wasserstoff ist, und,

R<sup>102</sup> und R<sup>102'</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Chlor oder Fluor bedeuten,

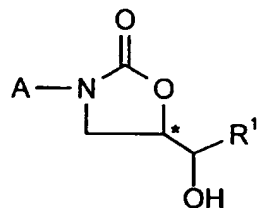
R<sup>103</sup> Wasserstoff ist,

n 1 ist,

und Tautomere und/oder Salze davon.

9. Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach irgendeinem der vorgehenden Ansprüche 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, daß R<sup>1</sup> ausgewählt wird aus Vinyl, Ethinyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Allyl, Benzyl, Phenyl, Trifluormethyl, und Difluormethyl.

10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach Anspruch 1,



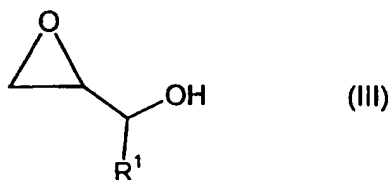
(I)

das umfaßt:

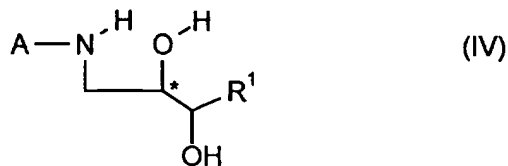
[A] die Umsetzung der Verbindungen der allgemeinen Formel (II)

A-NH<sub>2</sub> (II)

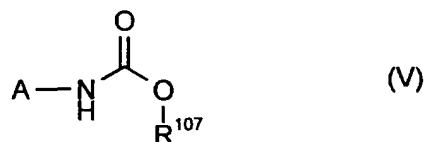
mit enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der allgemeinen Formel (III)



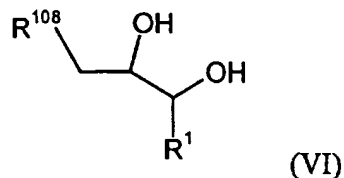
worin A und R<sup>1</sup> die im Anspruch 1 angegebene Bedeutung besitzen, in inerten Lösemitteln und in Anwesenheit eines Hilfsmittels zu enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der Formel (IV)



die weiter mit Carbonyldiimidazol in inerten Lösemitteln zu enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) cyclisiert werden, oder  
[B] die Umsetzung von Verbindungen der Formel (V)



worin A die im Anspruch 1 angegebene Bedeutung aufweist und R<sup>107</sup> wahlweise substituiertes, vorzugsweise durch 1 bis 3 Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, wie z. B. Methyl, Ethyl, Propyl oder Trifluormethyl, Phenyl, substituiertes Phenyl, bevorzugt 2- oder 4-Nitrophenyl, oder bevorzugt Benzyl ist, mit enantiomerenreinen oder racemischen Verbindungen der allgemeinen Formel (VI)



worin R<sup>1</sup> die im Anspruch 1 angegebene Bedeutung aufweist und R<sup>108</sup> eine übliche Abgangsgruppe ist, wie z. B. Halogen, wie Chlor oder Brom, oder -O-SO<sub>2</sub>-R<sup>109</sup>, worin R<sup>109</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Alkyl, oder gegebenenfalls (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsubstituiertes Phenyl ist,  
in Gegenwart von Basen zu Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und gegebenenfalls anschließend die Umwandlung am Rest R<sup>1</sup> in z. B. Ester oder Amide nach üblichen Methoden.

11. Pharmazeutische Zusammensetzung, die eine Verbindung gemäß irgend einem der Ansprüche 1 bis 9 in Mischung mit einem pharmazeutisch verträglichen Träger bzw. Exzipienten umfaßt.

12. Verbindung nach irgend einem der Ansprüche 1 bis 9 zur Verwendung als Arzneimittel.

13. Verwendung einer Verbindung nach irgend einem der Ansprüche 1 bis 9 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung bakterieller Infektionen.